

This Page Is Inserted by IFW Operations
and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

**As rescanning documents *will not* correct images,
please do not report the images to the
Image Problems Mailbox.**



⑯ BUNDESREPUBLIK
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES
PATENTAMT

⑯ Offenlegungsschrift
⑯ DE 196 23 744 A 1

⑮ Int. Cl. 6:
C 07 C 233/53

C 07 C 229/62
C 07 C 233/57
C 07 C 233/64
C 07 C 235/76
C 07 C 237/30
C 07 C 251/24
C 07 C 251/48
C 07 C 275/42
A 01 N 37/22
A 01 N 33/06
A 01 N 53/02
// C07D 521/00

DE 196 23 744 A 1

⑯ Aktenzeichen: 196 23 744.0
⑯ Anmeldetag: 14. 6. 96
⑯ Offenlegungstag: 18. 12. 97

⑰ Anmelder:
Bayer AG, 51373 Leverkusen, DE

⑰ Erfinder:
Elbe, Hans-Ludwig, Dr., 42329 Wuppertal, DE;
Dutzmann, Stefan, Dipl.-Agr.-Ing. Dr., 40721 Hilden,
DE; Stenzel, Klaus, Dipl.-Biol. Dr., 40595 Düsseldorf,
DE

⑯ Aminophthalsäurederivate

⑯ Die vorliegende Anmeldung betrifft die Verwendung von
Aminophthalsäurederivaten als Fungizide, sowie neue Ami-
nophthalsäurederivate und mehrere Verfahren zu deren
Herstellung.

DE 196 23 744 A 1

Die folgenden Angaben sind den vom Anmelder eingereichten Unterlagen entnommen

BUNDESDRUCKEREI 10. 97 702 051/254

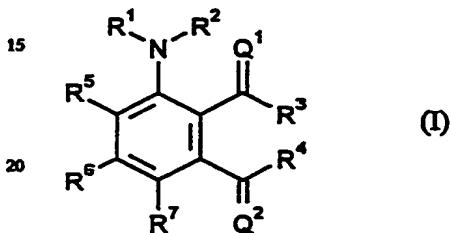
50/33

Beschreibung

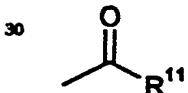
Die vorliegende Anmeldung betrifft die Verwendung von Aminophthalsäurederivaten als Fungizide, sowie neue Aminophthalsäurederivate und mehrere Verfahren zu deren Herstellung.

Bestimmte Aminophthalsäurederivate, wie beispielsweise 3-Acetylamino-phthalsäuredimethylester, 3-Aminophthalsäuredimethylester, 3-Aminophthalsäurediethylester, 3-Aminophthalsäure-1-methylester, 3-Aminophthalsäure-2-methylester und 3-Aminophthalsäure, sind bereits aus der chemischen Literatur bekannt (vergleiche z. B. J. Heterocycl. Chem. (1973) 891 – 9, J. Amer. Chem. Soc., (1937) 2580 – 3, Justus Liebigs Ann. Chem., (1881) 246, J. Amer. Chem. Soc., (1909) 486, J. Med. Chem. (1988) 1466 – 1471, Chem. Ber., (1886), 166, JP 04182460).

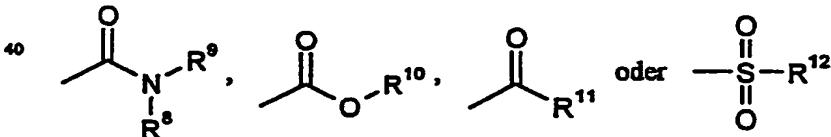
Eine fungizide Wirkung dieser Verbindungen ist aber bisher nicht beschrieben worden.
Es wurde nun gefunden, daß die Aminophthalsäurederivate der allgemeinen Formel (I),



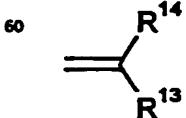
25 in welcher
Q¹ und Q² gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Sauerstoff oder Schwefel stehen,
R¹ für Wasserstoff oder die Gruppierung



35 steht, worin R¹¹ die unten angegebene Bedeutung hat,
R² für Wasserstoff oder eine der nachfolgenden Gruppierungen



45 steht,
worin
R⁸ für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,
R⁹ für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder
50 R⁸ und R⁹ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocycli stehen,
R¹⁰ für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Aryl oder Cycloalkyl substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl oder für Heterocycli steht,
R¹¹ für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl,
55 Aryl, Arylalkyl oder Heterocycli steht,
R¹² für Alkyl, Aryl oder Heterocycli steht, oder
R¹ und R² gemeinsam für eine Gruppierung



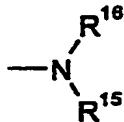
65 stehen, worin
R¹³ für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl oder gegebenenfalls substituiertes Heterocycli steht und

DE 196 23 744 A1

R¹⁴ für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Aryl, Heterocycl, Alkoxy oder Dialkylamino steht oder

R¹³ und R¹⁴ gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cycloalkylen stehen, oder R¹ und R² gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocycl stehen,

R³ und R⁴ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Arylalkoxy, Cycloalkoxy, Cycloalkenyoxy, Aryloxy, Heterocyclyoxy, Mercapto, Alkylothio, Alkenylothio, Alkinylothio, Arylalkylothio, Cycloalkylothio, Cycloalkenyoxy, Arylothio, Heterocyclylothio oder



10

15

stehen, wobei

R¹⁵ für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,

R¹⁶ für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder

R¹⁵ und R¹⁶ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocycl stehen und

R⁵, R⁶ und R⁷ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl, Alkoxy, Alkylothio, Halogenalkyl, Halogenalkoxy oder Halogenalkylothio stehen, gut zur Bekämpfung von Schädlingen verwendet werden können.

Die Verbindungen der Formel (I) wiesen dabei eine sehr starke fungizide Wirkung im Pflanzenschutz auf.

In den Definitionen sind die gesättigten oder ungesättigten Kohlenwasserstoffketten, wie Alkyl oder Alkenyl, auch in Verknüpfung mit Heteroatomen, wie in Alkoxy, Alkylothio oder Alkylamino, jeweils geradkettig oder verzweigt.

Halogen steht im allgemeinen für Fluor, Chlor, Brom oder Iod, vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom, insbesondere für Fluor oder Chlor.

Aryl steht für aromatische, mono- oder polycyclische Kohlenwasserstoffringe, wie z. B. Phenyl, Naphthyl, Anthranyl, Phenanthryl, vorzugsweise Phenyl oder Naphthyl, insbesondere Phenyl.

Heterocycl steht für gesättigte oder ungesättigte, sowie aromatische, ringförmige Verbindungen, in denen mindestens ein Ringglied ein Heteroatom, d. h. ein von Kohlenstoff verschiedenes Atom, ist. Enthält der Ring mehrere Heteroatome, können diese gleich oder verschieden sein. Enthält der Ring mehrere Sauerstoffatome, stehen diese nicht benachbart. Heteroatome sind bevorzugt Sauerstoff, Stickstoff oder Schwefel.

Cycloalkyl steht für gesättigte, carbocyclische, ringförmige Verbindungen.

Cycloalkenyl steht für carbocyclische, ringförmige Verbindungen, die mindestens eine Doppelbindung enthalten.

Alle genannten ringförmigen Verbindungen bilden gegebenenfalls mit weiteren carbocyclischen oder heterocyclischen, ankondensierten oder überbrückten Ringen gemeinsam ein polycyclisches Ringsystem.

Überraschenderweise zeigen die in dieser Anmeldung genannten Stoffe eine viel stärkere fungizide Wirkung als konstitutionell ähnliche Verbindungen, wie beispielsweise Benzoesäure, mit gleicher Wirkungsrichtung.

Bevorzugt ist die Verwendung der Verbindungen der Formel (I), in welcher

Q¹ und Q² gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Sauerstoff oder Schwefel stehen, R¹ für Wasserstoff oder die Gruppierung

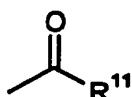
25

30

35

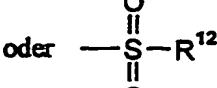
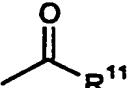
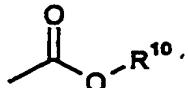
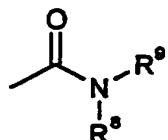
40

50



steht, worin R¹¹ die unten angegebene bevorzugte Bedeutung hat, steht, R² für Wasserstoff oder eine der nachfolgenden Gruppierungen

55



60

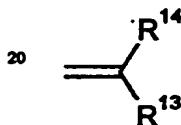
steht, worin

R⁸ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1—5 gleichen oder verschiedenen

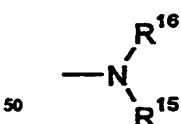
65

DE 196 23 744 A1

Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,
 R⁹ für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder
 R⁸ und R⁹ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes
 Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen,
 5 R¹⁰ für gegebenenfalls durch Phenyl oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen substituiertes Alkyl mit 1 bis
 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkinyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl
 mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen oder für Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,
 R¹¹ für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Alkoxy carbonyl, Alkyl carbonyl oder Carboxy substituiertes
 10 Alkyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkinyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffato-
 men oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl
 mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen oder Halogen substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 8
 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Aryl, Arylalkyl oder Heterocycl mit 3 bis 7
 Ringgliedern steht,
 R¹² für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Phenyl, Naphthyl oder Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,
 15 oder
 R¹ und R² gemeinsam für eine Gruppierung

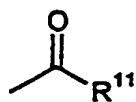


25 stehen, worin
 R¹³ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3
 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach
 durch Alkyl, Alkoxy, Halogen, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycl mit 3 bis
 7 Ringgliedern steht und
 30 R¹⁴ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3
 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenyl, Naphthyl, Heterocycl mit 3 bis 7
 Ringgliedern, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in
 den Alkylteilen steht oder
 R¹³ und R¹⁴ gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cycloalkyliden mit 3 bis 7
 35 Kohlenstoffatomen stehen, oder
 R¹ und R² gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes
 Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen,
 R³ und R⁴ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 12 Kohlen-
 40 stoffatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkinyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Phenylal-
 koxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkoxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyloxy
 mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenoxy, Heterocyclyoxy mit 3 bis 7 Ringgliedern, Mercapto, Alkythio mit 1 bis
 4 Kohlenstoffatomen, Alkenylthio mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkinylthio mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen,
 Arylalkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkylthio mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloal-
 kenylthio mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenylothio, Heterocyclylothio mit 3 bis 7 Ringgliedern oder
 45



stehen, wobei
 R¹⁵ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils
 55 gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,
 Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1-5 gleichen oder verschiedenen
 Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,
 R¹⁶ für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder
 R¹⁵ und R¹⁶ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach
 60 durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen, und
 R⁵, R⁶ und R⁷ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro,
 Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkythio mit 1 bis 4 Kohlenstoffato-
 men, Halogenalkyl, Halogenalkoxy oder Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5
 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen stehen.

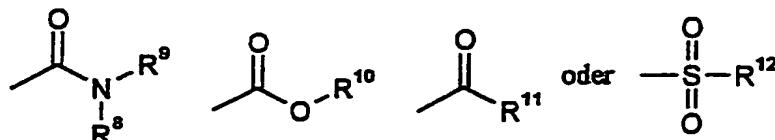
65 Besonders bevorzugt ist die Verwendung der Verbindungen der Formel (I), in welcher
 Q¹ und Q² gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Sauerstoff oder Schwefel stehen,
 R¹ für Wasserstoff oder die Gruppierung



5

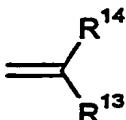
steht,
worin R¹¹ die unten angegebene, besonders bevorzugte Bedeutung hat, steht,
R² für Wasserstoff oder eine der nachfolgenden Gruppierungen

10



15

steht, worin
R⁸ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy oder Difluorchlormethoxy, substituiertes Phenyl, Naphthyl, Thienyl, Pyridyl oder Furyl steht, 20
R⁹ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht, oder
R⁸ und R⁹ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl oder Piperazinyl stehen, 25
R¹⁰ für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Benzyl, 1-Phenylethyl, 2-Phenylethyl, Cyclohexyimethyl, Allyl, Propargyl, Oxethan-3-yl steht,
R¹¹ für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Acetyl oder Carboxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Vinyl, Allyl, Propargyl, Penta-1,3-dien-1-yl oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Thienyl, Furyl, Pyrazolyl, Pyridyl oder 2,3-Dihydro[1,4]oxathiin steht, 30
R¹² für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Phenyl, Naphthyl, Thienyl, Furyl oder Pyridyl steht, oder
R¹ und R² gemeinsam für eine Gruppierung 35



40

stehen, worin
R¹³ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Vinyl, Allyl, Propargyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Phenyl, Methylphenyl, Fluorphenyl, Chlorophenyl, Bromphenyl, Cyanphenyl, Methoxyphenyl, Nitrophenyl, Thienyl, Furyl, Pyridyl oder Chlorpyridyl steht und
R¹⁴ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Allyl, Propargyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl, Thienyl, Furyl oder Pyridyl, Methoxy, Ethoxy, Dimethylamino, Diethylamino steht oder
R¹³ und R¹⁴ gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cyclopropyliden, Cyclobutyliden, Cyclopentyliden oder Cyclohexyliden stehen, oder
R¹ und R² gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl, Piperazinyl oder Succinimidyl stehen, 55
R³ und R⁴ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Pentoxy, Hexyloxy, Heptyloxy, Octyloxy, Nonyloxy, Decyloxy, Undecyloxy, Dodecyloxy, Allyloxy, Propargyloxy, Benzyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclohexenyloxy, Phenoxy, Oxetan-3-yloxy, Mercapto, Methylthio, Ethylthio, Allylthio, Propargylthio, Benzylthio, Cyclopentylthio, Cyclohexylthio, Cyclohexenythio, Phenylthio, Amino, Methylamino, Ethylamino, Dimethylamino, Phenylamino oder über ein Stickstoffatom gebundenes, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl oder Piperazinyl stehen und
R⁵, R⁶ und R⁷ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluormethylthio, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio stehen.

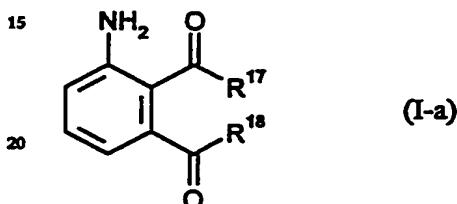
Diese Restedefinitionen können untereinander, also auch zwischen den angegebenen Bereichen bevorzugter

Verbindungen, beliebig kombiniert werden.

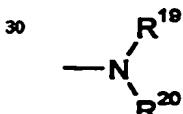
Bevorzugt verwendbare Verbindungen sind auch Additionsprodukte aus Säuren und denjenigen Aminophthalsäurederivaten der Formel (I), in denen R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, Q¹ und Q² diejenigen Bedeutungen haben, die für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.

5 Zu den Säuren, die addiert werden können, gehören vorzugsweise Halogenwasserstoffsäuren, wie z. B. die Chlorwasserstoffsäure und die Bromwasserstoffsäure, insbesondere die Chlorwasserstoffsäure, ferner Phosphorsäure, Schwefelsäure, Salpetersäure, mono- und bifunktionelle Carbonsäuren und Hydroxycarbonsäuren, wie z. B. Essigsäure, Maleinsäure, Bernsteinsäure, Fumarsäure, Weinsäure, Zitronensäure, Salicylsäure, Sorbinsäure und Milchsäure, sowie Sulfonsäuren, wie z. B. p-Toluolsulfonsäure, 1,5-Naphthalindisulfonsäure, Saccharin und Thiosaccharin.

10 Weiterhin Gegenstand der vorliegenden Anmeldung sind neue Aminophthalsäurederivate der allgemeinen Formel (I-a),



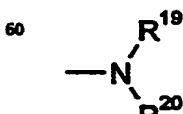
25 in welcher R¹⁷ und R¹⁸ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Arylalkoxy, Cycloalkoxy, Cycloalkenyloxy, Aryloxy, Heterocyclxy oder



35 stehen, wobei R¹⁹ für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht, R²⁰ für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder R¹⁹ und R²⁰ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes

40 Heterocycl stehen,
wobei die Verbindungen
3-Aminophthalsäuredimethylester,
3-Aminophthalsäurediethylester,
3-Aminophthalsäredi-n-propylester,
45 3-Aminophthalsäure-1-methylester,
3-Aminophthalsäure-2-methylester,
3-Aminophthalsäure,
3-Aminophthalimid,
2-(N-Methyl-N-phenyl-carbamoyl)-6-amino-benzanilid,
50 1,2-Bis-(N-methyl-N-phenyl-carbamoyl)-3-amino-benzol und
2-(N-Methyl-N-phenyl-carbamoyl)-3-carbomethoxy-anilin,
ausgenommen sind.

Bevorzugt sind neue Verbindungen der Formel (I-a), in welcher R¹⁷ und R¹⁸ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkinyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Phenylalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkyteil, Cycloalkoxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyloxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenoxy, Heterocyclxy mit 3 bis 7 Ringgliedern, oder



65 stehen, wobei R¹⁹ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,

DE 196 23 744 A1

Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1—5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht, R²⁰ für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder R¹⁹ und R²⁰ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen.

Besonders bevorzugt sind neue Verbindungen der Formel (I-a), in welcher R¹⁷ und R¹⁸ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Pentoxy, Hexyloxy, Heptyloxy, Octyloxy, Nonyloxy, Decyloxy, Undecyloxy, Dodecyloxy, Allyloxy, Propargyloxy, Benzylloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclohexenyloxy, Phenoxy, Oxetan-3-yloxy, Amino, Methylamino, Ethylamino, Dimethylamino, Phenylamino oder über ein Stickstoffatom gebundenes, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl oder Piperazinyl stehen.

Ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Anmeldung sind neue Aminophthsäurederivate der allgemeinen Formel (I-b),

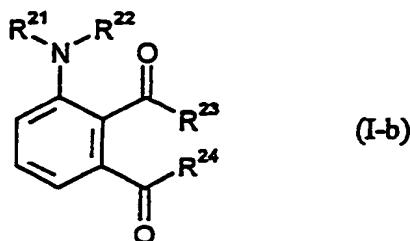
5

10

15

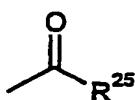
20

25



in welcher
R²¹ für Wasserstoff oder die Gruppierung

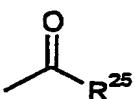
30



35

steht, worin R²⁵ die unten angegebene Bedeutung hat,
R²² für die Gruppierung

40



45

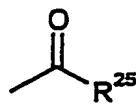
steht, worin
R²⁵ für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkanyl, Cycloalkyl, Cycloalkeny, Aryl, Arylalkyl oder Heterocycl steht,
R²³ und R²⁴ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Arylalkoxy, Cycloalkoxy, Cycloalkenyloxy, Aryloxy, Heterocyclxyoxy stehen, wobei R²³ und R²⁴ nicht gleichzeitig für Hydroxy stehen und die Verbindungen 3-Acetylarno-phthsäuredimethylester und

50

3-Acetylarno-phthsäure-1-methylester ausgenommen sind.

Bevorzugt sind neue Verbindungen der Formel (I-b), in welcher
R²¹ für Wasserstoff oder die Gruppierung

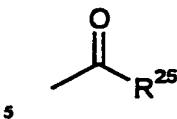
55



60

steht,
worin R²⁵ die unten angegebene bevorzugte Bedeutung hat,
R²² für die Gruppierung

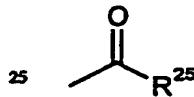
65



steht, worin
R²⁵ für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Alkoxy carbonyl, Alkyl carbonyl oder Carboxy substituiertes
Alkyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkinyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen
oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl
mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen oder Halogen substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 8
Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Aryl, Arylalkyl oder Heterocycl mit 3 bis 7
Ringgliedern steht,

R²³ und R²⁴ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 12
Kohlenstoffatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkinyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen,
Phenylalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkynteil, Cycloalkoxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloal-
kenyloxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenoxy, Heterocyclyoxy mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen, wobei R²³
und R²⁴ nicht gleichzeitig für Hydroxy stehen.

Besonders bevorzugt sind neue Verbindungen der Formel (I-b), in welcher
20 R²¹ für Wasserstoff oder die Gruppierung

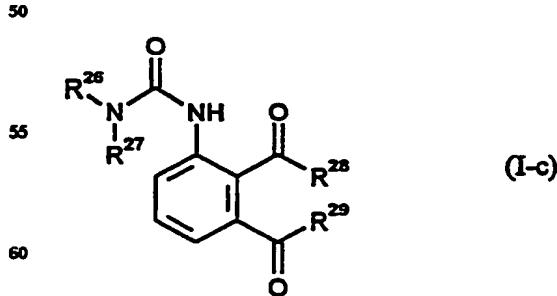


steht,
worin R²⁵ die unten angegebene besonders bevorzugte Bedeutung hat,
30 R²² für die Gruppierung



steht, worin
R²⁵ für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Acetyl oder Carboxy
substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Vinyl, Allyl, Propargyl, Penta-1,3-dien-1-yl
oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Fluor, Chlor oder Brom
substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Thiienyl, Furyl, Pyrazolyl, Pyridyl
oder 2,3-Dihydro[1,4]oxathia steht,
R²³ und R²⁴ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Methoxy, Eethoxy, n- oder
i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Pentoxy, Hexyloxy, Heptyloxy, Octyloxy, Nonyloxy, Decyloxy, Undecyloxy,
Dodecyloxy, Allyloxy, Propargyloxy, Benzyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclohexenyloxy, Phenoxy
oder Oxetan-3-yloxy stehen, wobei R²³ und R²⁴ nicht gleichzeitig für Hydroxy stehen.

Weiterhin Gegenstand der vorliegenden Anmeldung sind neue Aminophthalsäurederivate der allgemeinen
Formel (I-c),



in welcher
65 R²⁶ für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,
R²⁷ für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder
R²⁶ und R²⁷ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes
Heterocycl stehen und

DE 196 23 744 A1

R²⁸ und R²⁹ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Arylalkoxy, Cycloalkoxy, Cycloalkenyloxy, Aryloxy, Heterocyclyoxy stehen.

Bevorzugt sind neue Verbindungen der Formel (I-c), in welcher
R²⁶ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1–5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,

R²⁷ für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder
R²⁶ und R²⁷ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen und

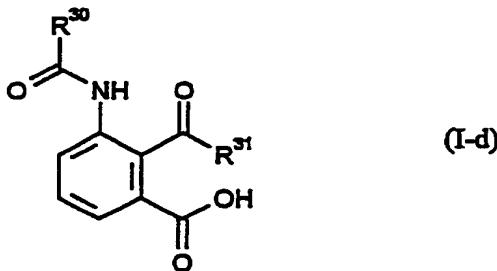
R²⁸ und R²⁹ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkinyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Phenylalkoxy mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkoxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyloxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenoxy oder Heterocyclyoxy mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen.

Besonders bevorzugt sind neue Verbindungen der Formel (I-c), in welcher
R²⁶ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy oder Difluorchlormethoxy, substituiertes Phenyl, Naphthyl, Thienyl, Pyridyl oder Furyl steht,

R²⁷ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht, oder
R²⁶ und R²⁷ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl oder Piperazinyl stehen und

R²⁸ und R²⁹ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Pentoxy, Hexyloxy, Heptyloxy, Octyloxy, Nonyloxy, Decyloxy, Undecyloxy, Dodecyloxy, Allyloxy, Propargyloxy, Benzyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclohexenyloxy, Phenoxy oder Oxetan-3-yloxy stehen.

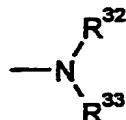
Weiterhin Gegenstand der vorliegenden Anmeldung sind neue Aminophthalsäurederivate der allgemeinen Formel (I-d),



in welcher

R³⁰ für gegebenenfalls substituiertes Heterocycl steht und

R³¹ für Hydroxy oder



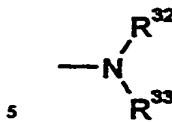
steht, wobei

R³² für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,

R³³ für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder

R³² und R³³ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocycl stehen.

Bevorzugt sind neue Verbindungen der Formel (I-d), in welcher
R³⁰ für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen oder Halogen substituiertes Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht und
R³¹ für Hydroxy oder

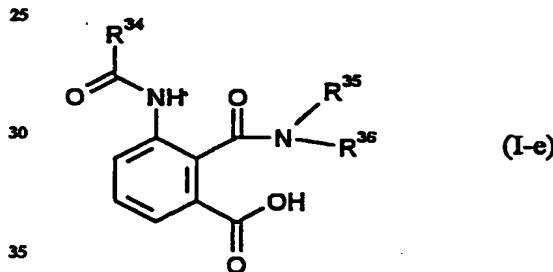


steht, wobei

- R³² für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1—5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,
R³³ für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder
R³² und R³³ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen.

- Besonders bevorzugt sind neue Verbindungen der Formel (I-d), in welcher
R³⁰ für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Thienyl, Furyl, Pyrazolyl, Pyridyl oder 2,3-Dihydro[1,4]oxathiin steht und
R³¹ für Hydroxy, Amino, Methylamino, Ethylamino, Dimethylamino, Phenylamino oder über ein Stickstoffatom gebundenes, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morphinyl oder Piperazinyl steht.

Weiterhin Gegenstand der vorliegenden Anmeldung sind neue Aminophthalsäurederivate der allgemeinen Formel (I-e).



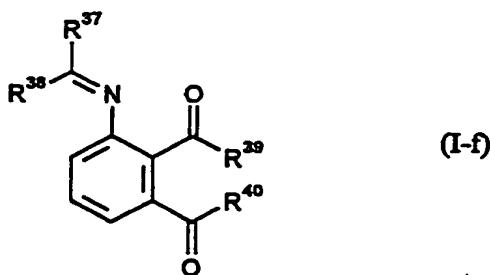
in welcher

- R³⁴ für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkanyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl oder Aryl steht,
R³⁵ für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Aryl oder Heteroaryl steht,
R³⁶ für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder
R³⁵ und R³⁶ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocycl steht.

- Bevorzugt sind neue Verbindungen der Formel (I-e), in welcher
R³⁴ für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Alkoxy carbonyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkanyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen oder Halogen substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Aryl oder Arylalkyl steht,
R³⁵ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1—5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,
R³⁶ für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder
R³⁵ und R³⁶ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen.

- Besonders bevorzugt sind neue Verbindungen der Formel (I-e), in welcher
R³⁴ für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Vinyl, Allyl, Propargyl, Penta-1,3-dien-1-yl oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl oder Benzyl steht,
R³⁵ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Phenyl, Cyclopropyl oder Oxethan-3-yl steht,
R³⁶ für Wasserstoff oder Methyl steht, oder
R³⁵ und R³⁶ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morphinyl oder Piperazinyl stehen.

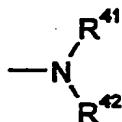
Ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Anmeldung sind neue Aminophthalsäurederivate der allgemeinen Formel (I-f),



5

10

in welcher
R³⁷ für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl oder gegebenenfalls substituiertes Heterocycli steht und
R³⁸ für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Aryl, Heterocycli, Alkoxy oder Dialkylamino steht oder
R³⁷ und **R³⁸** gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cycloalkylienen stehen, und
R²⁹ und **R⁴⁰** gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy, 20
Alkinyloxy, Arylalkoxy, Cycloalkoxy, Cycloalkenyloxy, Aryloxy, Heterocyclyloxy, Mercapto, Alkylothio, Alkenylothio, Alkinylothio, Arylalkylothio, Cycloalkylothio, Cycloalkenylothio, Arylothio, Heterocyclylothio oder



25

30

stehen, wobei
R⁴¹ für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,
R⁴² für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder
R⁴¹ und **R⁴²** gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocycli stehen.

35

Bevorzugt sind neue Verbindungen der Formel (I-f), in welcher
R³⁷ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl, Alkoxy, Halogen, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycli mit 3 bis 7 Ringgliedern steht und

40

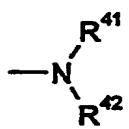
R³⁸ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Phenyl, Heterocycli mit 3 bis 7 Ringgliedern, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylketten steht oder

45

R³⁷ und **R³⁸** gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cycloalkylienen mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen stehen, und

R³⁹ und **R⁴⁰** gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkinyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Phenylalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkoxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyloxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenoxy, Heterocyclyloxy mit 3 bis 7 Ringgliedern, Mercapto, Alkylothio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenylothio mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkinylothio mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Arylalkylothio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkylothio mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenylothio mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenylthio, Heterocyclylothio mit 3 bis 7 Ringgliedern oder

55



60

stehen, wobei
R⁴¹ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1-5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycli mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,
R⁴² für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder
R⁴¹ und **R⁴²** gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach

durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen.

Besonders bevorzugt sind neue Verbindungen der Formel (I-f), in welcher

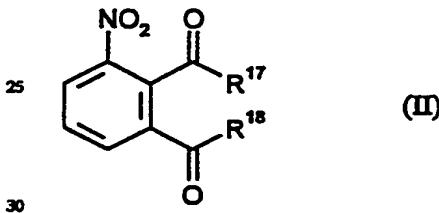
R³⁷ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Vinyl, Allyl, Propargyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Phenyl, Methylphenyl, Fluorphenyl, Chlorphenyl, Bromphenyl, Cyanphenyl, Methoxyphenyl, Nitrophenyl, Thienyl, Furyl, Pyridyl oder Chlorpyridyl steht und

R³⁸ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, s-, i- oder t-Butyl, Vinyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Phenyl, Thienyl oder Pyridyl, Methoxy, Ethoxy, Dimethylamino oder Diethylamino steht oder

R³⁷ und R³⁸ gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cyclopentyliden oder Cyclohexyliden stehen, und

R³⁹ und R⁴⁰ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Pentoxy, Hexyloxy, Heptyloxy, Octyloxy, Nonyloxy, Decyloxy, Undecyloxy, Dodecyloxy, Allyloxy, Propargyloxy, Benzyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclohexenyoxy, Phenoxy, Oxetan-3-yloxy, Mercapto, Methylthio, Ethylthio, Allylthio, Propargylthio, Benzylthio, Cyclopentylthio, Cyclohexylthio, Cyclohexenylthio, Phenylthio, Amino, Methylamino, Ethylamino, Dimethylamino, Phenylamino oder über ein Stickstoffatom gebundenes, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl oder Piperazinyl stehen.

Die Verbindungen der Formel (I-a) werden erhalten (Verfahren a), wenn man Nitrophthalsäurederivate der Formel (II)



in welcher

R^{17} und R^{18} die oben angegebenen Bedeutungen haben,

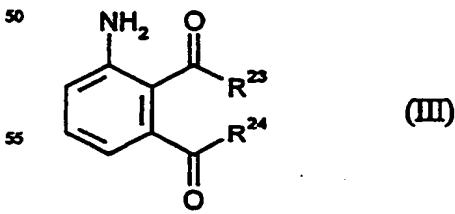
mit einem Reduktionsmittel, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, umgesetzt.

Die zur Durchführung des erfundungsgemäßen Verfahrens a) als Ausgangsstoffe benötigten Nitrophthalsäurederivate sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel (II) haben R^{17} und R^{18} vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfundungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-a) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R^{17} und R^{18} angegeben wurden.

Die Ausgangsstoffe der Formel (II) sind bekannt (vergleiche z. B. Bull. Soc. Chim. Fr. (1968), 4947–53; Chem. Ber., (1902) 3872, Anal. Chem., (1994) 1302–1315) und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (siehe auch die Herstellungsbeispiele).

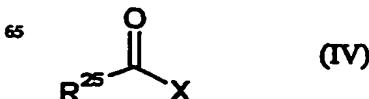
Als Reduktionsmittel zur Durchführung des erfundungsgemäßen Verfahrens a) kommen alle für derartige Reaktionen übliche Stoffe in Frage. Vorzugsweise seien genannt: Wasserstoff, Metalle, wie beispielsweise Zink, Eisen oder Zinn; oder Salze, wie beispielsweise Zinn-(II)-chlorid, Natriumdithionit oder Natriumhydrogensulfid.

Die Verbindungen der Formel (I-b) werden erhalten (Verfahren b), wenn man Aminoverbindungen der Formel (III)



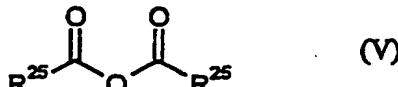
in welcher

R^{23} und R^{24} die oben angegebenen Bedeutungen haben,
mit einem Säurehalogenid der Formel (IV)



in welcher
 R^{25} die oben angegebene Bedeutung hat und
 X für Halogen steht,
oder mit einem Säureanhydrid der Formel (V)

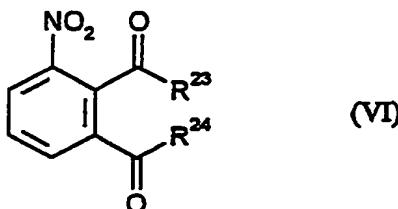
5



10

in welcher
 R^{25} die oben angegebene Bedeutung hat,
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, umsetzt,
oder wenn man (Verfahren c) Nitroverbindungen der Formel (VI)

15



20

25

in welcher
 R^{23} und R^{24} die oben angegebenen Bedeutungen haben,
in Gegenwart eines Säureanhydrids der Formel (V) mit Wasserstoff, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdün- 30
nungsmittels und in Gegenwart eines Katalysators, umsetzt.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens b) als Ausgangsstoffe benötigten Aminoverbindungen sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel (III) haben R^{23} und R^{24} vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-b) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R^{23} und R^{24} angegeben wurden. 35

Die Ausgangsstoffe der Formel (III) sind entweder bekannt und können nach an sich bekannten Verfahren erhalten werden (vergleiche z. B. J. Heterocycl. Chem. (1973) 891–9, J. Amer. Chem. Soc. (1937) 2580–3, Justus Liebigs Ann. Chem., (1881) 246, J. Amer. Chem. Soc., (1909) 486, J. Med. Chem. (1988) 1466–1471, Chem. Ber., (1886), 166) oder sind erfindungsgemäße Verbindungen der Formel (I-a) und können nach Verfahren a) hergestellt werden. 40

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens b) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Säurehalogenide sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In dieser Formel (IV) hat R^{25} vorzugsweise bzw. insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-b) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R^{25} angegeben wurde. X steht für Halogen, vorzugsweise für Chlor. 45

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens b) alternativ als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Säureanhydride sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel (V) hat R^{25} vorzugsweise bzw. insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-b) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R^{25} angegeben wurde. 50

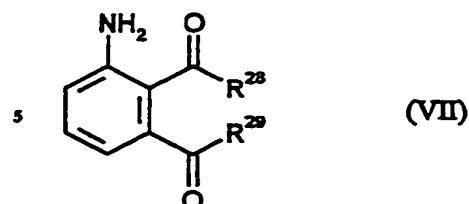
Die Säurehalogenide der Formel (IV) und die Säureanhydride der Formel (V) sind bekannte Synthesechemikalien.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens c) als Ausgangsstoffe benötigten Nitroverbindungen sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In dieser Formel (VI) haben R^{23} und R^{24} vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-b) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R^{23} und R^{24} angegeben wurden. 55

Die Ausgangsstoffe der Formel (VI) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vergleiche z. B. Bull. Soc. Chim. Fr. (1968), 4947–53; Chem. Ber., (1902) 3872, JP 04182460).

Die Verbindungen der Formel (I-c) werden erhalten (Verfahren d), wenn man Aminoverbindungen der Formel (VII)

65

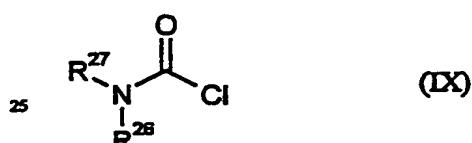


10 in welcher R^{28} und R^{29} die oben angegebenen Bedeutungen haben,
mit einem Isocyanat der Formel (VIII)

$$15 \quad R^{28}-N=C=O \quad (VIII)$$

in welcher R²⁶ die oben angegebene Bedeutung hat,
oder mit einem Carbamoylchlorid der Formel (IX)

30



30 in welcher R²⁶ und R²⁷ die oben angegebenen Bedeutungen haben,
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzep-
tors umsetzt.

35 Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens d) als Ausgangsstoffe benötigten Aminoverbindungen sind durch die Formel (VII) allgemein definiert. In dieser Formel (VII) haben R²⁸ und R²⁹ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-c) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R²⁸ und R²⁹ angegeben wurden.

40 Die Ausgangsstoffe der Formel (VII) sind entweder bekannt und können nach an sich bekannten Verfahren erhalten werden (vergleiche z. B. J. Heterocycl. Chem. (1973) 891-9, J. Amer. Chem. Soc., (1937) 2580-3, Justus Liebigs Ann. Chem., (1881) 246, J. Amer. Chem. Soc., (1909) 486, J. Med. Chem. (1988) 1466-1471, Chem. Ber. (1886), 166) oder sind erfundungsgemäße Verbindungen der Formel (I-a) und können nach Verfahren a) hergestellt werden.

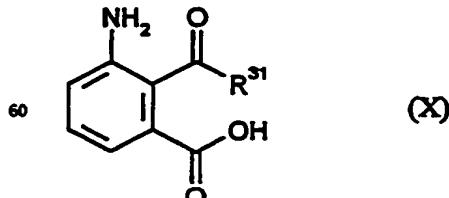
45 Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens d) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Isocyanate sind durch die Formel (VIII) allgemein definiert. In dieser Formel (VIII) hat R^{26} vorzugsweise bzw. insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-c) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R^{26} angegeben wurde.

50 Verbindungen der Formel (I-c) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R²⁶ angegeben wurde.
 Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens d) alternativ als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Carbamoylchloride sind durch die Formel (XIX) allgemein definiert. In dieser Formel (IX) haben R²⁶ und R²⁷ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-c) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R²⁶ und R²⁷ angegeben wurden.

Die Isoxycyanate der Formel (VIII) und die Säureanhydride der Formel (IX) sind bekannte Synthesekomplexe.

Die Eozyanate der Formel (VIII) und die Sauerstoffanhydrite der Formel (IX) sind bekannte Syntheseverfahren. Die Verbindungen der Formel (I-d) werden erhalten (Verfahren e), wenn man Aminoverbindungen der Formel (X)

55



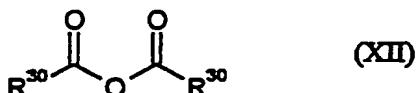
65 in welcher
R³¹ die oben angegebene Bedeutung hat,
mit einem Schwebelatzenid des Formal (VII)



5

in welcher
 R^{30} die oben angegebene Bedeutung hat und
 Y für Halogen steht,
oder mit einem Säureanhydrid der Formel (XII)

10



15

in welcher
 R^{30} die oben angegebene Bedeutung hat,
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakze-
tors, umsetzt.

20

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens e) als Ausgangsstoffe benötigten Aminoverbindun-
gen sind durch die Formel (X) allgemein definiert. In dieser Formel (X) hat R^{31} vorzugsweise bzw. insbesondere
diejenige Bedeutung, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindun-
gen der Formel (I-d) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R^{31} angegeben wurde.

25

Die Ausgangsstoffe der Formel (X) sind eine Untergruppe der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel
(I-a) und können nach Verfahren a) hergestellt werden.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens e) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Säure-
halogenide sind durch die Formel (XI) allgemein definiert. In dieser Formel (XI) hat R^{30} vorzugsweise bzw.
insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen
Verbindungen der Formel (I-d) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R^{30} angegeben wurde. Y steht
für Halogen, vorzugsweise für Chlor.

30

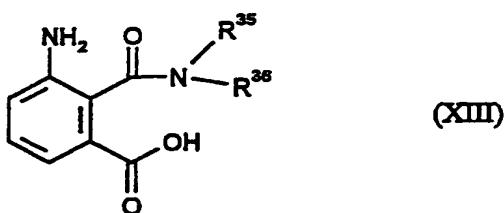
Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens e) alternativ als Ausgangsstoffe weiterhin benötig-
ten Säureanhydride sind durch die Formel (XII) allgemein definiert. In dieser Formel (XII) hat R^{30} vorzugsweise bzw.
insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsge-
mäßen Verbindungen der Formel (I-d) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R^{30} angegeben wurde.

35

Die Säurehalogenide der Formel (XI) und die Säureanhydride der Formel (XII) sind bekannte Synthesekemi-
kalien.

Die Verbindungen der Formel (I-e) werden erhalten (Verfahren f), wenn man Aminoverbindungen der Formel
(XIII)

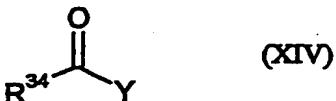
40



45

in welcher
 R^{35} und R^{36} die oben angegebenen Bedeutungen haben,
mit einem Säurehalogenid der Formel (XIV)

50



60

in welcher
 R^{34} die oben angegebene Bedeutung hat und
 Z für Halogen steht,
oder mit einem Säureanhydrid der Formel (XV)

65



(XV)

in welcher
R³⁴ die oben angegebene Bedeutung hat,
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, umsetzt.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens f) als Ausgangsstoffe benötigten Aminoverbindungen sind durch die Formel (XIII) allgemein definiert. In dieser Formel (XIII) haben R³⁵ und R³⁶ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-e) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R³⁵ und R³⁶ angegeben wurden.

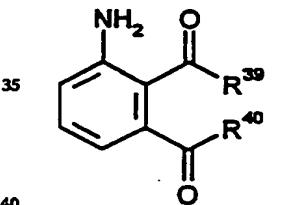
Die Ausgangsstoffe der Formel (XIII) sind eine Untergruppe der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-a) und können nach Verfahren a) hergestellt werden.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens f) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Säurehalogenide sind durch die Formel (XIV) allgemein definiert. In dieser Formel (XIV) hat R³⁴ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-e) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R³⁴ angegeben wurde. Z steht für Halogen, vorzugsweise für Chlor.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens f) alternativ als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Säureanhydride sind durch die Formel (XV) allgemein definiert. In dieser Formel (XV) hat R³⁴ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-e) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R³⁴ angegeben wurde.

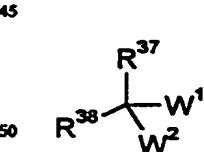
Die Säurehalogenide der Formel (XIV) und die Säureanhydride der Formel (XV) sind bekannte Synthesekalzien.

Die Verbindungen der Formel (I-f) werden erhalten (Verfahren g), wenn man Aminoverbindungen der Formel (XVI)



(XVI)

in welcher
R³⁹ und R⁴⁰ die oben angegebenen Bedeutungen haben,
mit einem Ketoderivat der Formel (XVII)



(XVII)

in welcher
R³⁷ und R³⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben und
W¹ und W² für Alkoxy stehen, oder gemeinsam für ein zweifach gebundenes Sauerstoffatom stehen,
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines sauren Katalysators, umsetzt.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens g) als Ausgangsstoffe benötigten Aminoverbindungen sind durch die Formel (XVI) allgemein definiert. In dieser Formel (XVI) haben R³⁵ und R⁴⁰ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-f) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R³⁵ und R⁴⁰ angegeben wurden.

Die Ausgangsstoffe der Formel (XVI) sind erfindungsgemäße Verbindungen der Formel (I-a) und können nach Verfahren a) hergestellt werden.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens g) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Ketoderivate sind durch die Formel (XVII) allgemein definiert. In dieser Formel (XVII) haben R³⁷ und R³⁸ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-f) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R³⁷ und

DE 196 23 744 A1

R³⁸ angegeben wurden. W¹ und W² stehen für Alkoxy, vorzugsweise für Methoxy oder Ethoxy, oder gemeinsam für ein zweifach gebundenes Sauerstoffatom.

Die Ketoderivate der Formel (XVII) sind bekannte Synthesechemikalien.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfundungsgemäßen Verfahrens a) kommen vorzugsweise in Frage: Ester, wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, n-, i-, sek- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethyleneglykolmonomethylether oder Diethylenglykolmonoethylether; Wasser, Salzlösungen, wie beispielsweise Ammoniumchloridlösung, wäßrige Säuren, wie beispielsweise Salzsäure oder Essigsäure, sowie beliebigen Mischungen der genannten Verdünnungsmittel.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfundungsgemäßen Verfahren b), d), e) und f) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Ketone, wie Aceton, Butanon, Methyl-isobutylketon oder Cyclohexanon; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; oder Sulfone, wie Sulfolan.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfundungsgemäßen Verfahrens c) kommen vorzugsweise in Frage: Ester, wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, n-, i-, sek- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethyleneglykolmonomethylether oder Diethylenglykolmonoethylether; oder organische Säuren, wie Essigsäure.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfundungsgemäßen Verfahrens g) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Ketone, wie Aceton, Butanon, Methyl-isobutylketon oder Cyclohexanon; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; oder Sulfone, wie Sulfolan.

Das erfundungsgemäße Verfahren a) wird gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators durchgeführt. Vorzugsweise kommen alle für katalytische Hydrierungen übliche Metallzubereitungen in Betracht, wie beispielsweise Raney-Nickel, feinverteiltes Palladium oder Platin, gegebenenfalls auf einem Trägermaterial, wie Aktivkohle oder Calciumcarbonat.

Als Katalysator zur Durchführung des erfundungsgemäßen Verfahrens c) kommen alle für katalytische Hydrierungen übliche Metallzubereitungen in Betracht, wie beispielsweise Raney-Nickel, feinverteiltes Palladium oder Platin, gegebenenfalls auf einem Trägermaterial, wie Aktivkohle oder Calciumcarbonat.

Die erfundungsgemäßen Verfahren b), d), e) und f) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Säureakzeptors durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen in Frage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydroxide, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogen-carbonat oder Natriumhydrogencarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylamin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Das erfundungsgemäße Verfahren g) wird gegebenenfalls in Gegenwart eines sauren Katalysators durchgeführt. Als solche kommen alle anorganischen und organischen Protonen- wie auch Lewissäuren, sowie auch alle polymeren Säuren in Frage. Hierzu gehören beispielsweise Chlorwasserstoff, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Ameisensäure, Essigsäure, Trifluoressigsäure, Methansulfonsäure, Trifluormethansulfonsäure, Toluolsulfonsäure, Bortrifluorid (auch als Etherat), Bortribromid, Aluminiumtrichlorid, Zinkchlorid, Eisen-III-chlorid, Antimonpentachlorid, saure Ionenaustauscher, saure Tonerden und saures Kieselgel.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfundungsgemäßen Verfahren a) bis g) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 0°C bis 80°C.

Zur Durchführung des erfundungsgemäßen Verfahrens a) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I-a) setzt man pro Mol des Nitrophthalsäurederivates der Formel (II) im allgemeinen 1 bis 15 Mol, vorzugsweise 2 bis 8 Mol des Reduktionsmittels ein.

Zur Durchführung des erfundungsgemäßen Verfahrens b) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I-b) setzt man pro Mol der Aminoverbindung der Formel (III) im allgemeinen 1 bis 15 Mol, vorzugsweise 2 bis 8 Mol Säurehalogenid der Formel (IV) oder Säureanhydrid der Formel (V) ein.

Zur Durchführung des erfundungsgemäßen Verfahrens c) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I-b) setzt man pro Mol der Nitroverbindung der Formel (VI) im allgemeinen 1 bis 15 Mol, vorzugsweise 2 bis 8 Mol Säureanhydrid der Formel (V) und 1 bis 100 Mol, vorzugsweise 1 bis 50 Mol Wasserstoff ein.

Zur Durchführung des erfundungsgemäßen Verfahrens d) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I-c) setzt man pro Mol der Aminoverbindung der Formel (VII) im allgemeinen 1 bis 15 Mol, vorzugsweise 2 bis 8 Mol

DE 196 23 744 A1

Isocyanat der Formel (VIII) oder Carbamoylchlorid der Formel (IX) ein.

Zur Durchführung des erfundungsgemäßen Verfahrens e) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I-d) setzt man pro Mol der Aminoverbindung der Formel (X) im allgemeinen 1 bis 15 Mol, vorzugsweise 2 bis 8 Mol Säurehalogenid der Formel (XI) oder Säureanhydrid der Formel (XII) ein.

5 Zur Durchführung des erfundungsgemäßen Verfahrens f) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I-e) setzt man pro Mol der Aminoverbindung der Formel (XIII) im allgemeinen 1 bis 15 Mol, vorzugsweise 2 bis 8 Mol Säurehalogenid der Formel (XIV) oder Säureanhydrid der Formel (XV) ein.

Zur Durchführung des erfundungsgemäßen Verfahrens g) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I-f) setzt man pro Mol der Aminoverbindung der Formel (XVI) im allgemeinen 1 bis 15 Mol, vorzugsweise 2 bis 8 Mol Ketoverbindung der Formel (XIV) oder Säureanhydrid der Formel (XV) ein.

10 Alle erfundungsgemäßen Verfahren werden im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck – im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar – zu arbeiten.

Die erfundungsgemäßen Wirkstoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen praktisch eingesetzt werden. Die Wirkstoffe sind für den Gebrauch als Pflanzenschutzmittel, insbesondere als Fungizide geeignet.

Fungizide Mittel im Pflanzenschutz werden eingesetzt zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes, Deuteromycetes.

20 Bakterizide Mittel werden im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae eingesetzt.

Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise Xanthomonas campestris pv. oryzae;

Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise Pseudomonas syringae pv. lachrymans;

25 Erwinia-Arten, wie beispielsweise Erwinia amylovora;

Pythium-Arten, wie beispielsweise Pythium ultimum;

Phytophthora-Arten, wie beispielsweise Phytophthora infestans;

Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise Pseudoperonospora humuli oder Pseudoperonospora cubensis;

Plasmopara-Arten, wie beispielsweise Plasmopara viticola;

30 Bremia-Arten, wie beispielsweise Bremia lactucae;

Peronospora-Arten, wie beispielsweise Peronospora pisi oder P. brassicae;

Erysiphe-Arten, wie beispielsweise Erysiphe graminis;

Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise Sphaerotheca fuliginea;

Podosphaera-Arten, wie beispielsweise Podosphaera leucotricha;

35 Venturia-Arten, wie beispielsweise Venturia inaequalis;

Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise Pyrenophora teres oder P. graminea (Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);

Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise Cochliobolus sativus (Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);

40 Uromyces-Arten, wie beispielsweise Uromyces appendiculatus;

Puccinia-Arten, wie beispielsweise Puccinia recondita;

Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise Sclerotinia sclerotiorum;

Tilletia-Arten, wie beispielsweise Tilletia caries;

Ustilago-Arten, wie beispielsweise Ustilago nuda oder Ustilago avenae;

45 Pellicularia-Arten, wie beispielsweise Pellicularia sasakii;

Pyricularia-Arten, wie beispielsweise Pyricularia oryzae;

Fusarium-Arten, wie beispielsweise Fusarium culmorum;

Botrytis-Arten, wie beispielsweise Botrytis cinerea;

Septoria-Arten, wie beispielsweise Septoria nodorum;

50 Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise Leptosphaeria nodorum;

Cercospora-Arten, wie beispielsweise Cercospora canescens;

Alternaria-Arten, wie beispielsweise Alternaria brassicæ;

Pseudocercosporella-Arten, wie beispielsweise Pseudocercosporella herpotrichoides.

Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens.

Dabei lassen sich die erfundungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Getreidekrankheiten, wie beispielsweise gegen Pseudocercosporella-Arten, oder von Krankheiten im Wein-, Obst- und Gemüseanbau, wie beispielsweise gegen Botrytis- und Plasmopara-Arten einsetzen.

60 Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulat, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

65 Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z. B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z. B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel

DE 196 23 744 A1

kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylool, Toluol oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylen oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z. B. Erdölfractionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylyketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z. B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z. B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsgsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z. B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnusschalen, Maiskolben und Tabakstengel. Als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z. B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z. B. Alkylarylpolyglycoether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen in Frage: z. B. Lignin-Sulfitablauen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z. B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurenährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90%.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z. B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d. h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen in Frage:

Fungizide:

Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin, Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticidiin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat, Calciumpolysulfid, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon, Chinomethionat (Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufra-neb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram, Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofuanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyridithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon, Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol, Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenitropan, Fenpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentinhydroxyd, Ferbam, Ferimzon, Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Aluminium, Fosetyl-Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxyd, Furametylpr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Furmecyclox, Guazatin, Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol, Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilate, Iminoctadintriacetate, Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IPB), Iprodione, Irumamycin, Isoprothiolan, Isovaliedione, Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid, Kupfernaphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Bordeaux-Mischung, Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanipyrim, Mepronil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax, Mildiomycin, Myclobutanil, Myclozolin, Nickel-dimethylthiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol, Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthiin, Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazol, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyrazophos, Pyrifenoxy, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxylfur, Quinconazol, Quintozene(PCNB), Schwefel und Schwefel-Zubereitungen, Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicyfen, Thifluzamide, Thio-phosphate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofosmethyl, Tolyfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol, Tridemorph, Triflumizol, Triforin, Triticonazol, Uniconazol, Validamycin A, Vinclozolin, Vimiconazol, Zarilamid, Zineb, Ziram sowie

- Dagger G,
OK-8705,
OK-8801,
2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4'-trifluor-methyl-1,3-thiazol-5-carboxaniid,
5 2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid,
2-Aminobutan,
2-Phenylphenol(OPP),
8-Hydroxychinolinsulfat,
cis-1-(4-Chlorophenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol,
10 (5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon,
 α -(2,4-Dichlorophenyl)- β -methoxy- α -methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
 α -(1,1-Dimethylethyl)- β -(phenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
1-[1-[2-[(2,4-Dichlorophenyl)methoxy]phenyl]ethenyl]-1H-imidazol,
bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)oxy]-2,5-thiophendicarboxylat,
15 2,6-Dichlor-N-[4-(trifluormethyl)phenyl]methyl]-benzamid,
(E)- α -(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid,
9H-Xanthen-9-carbonsäure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,
O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioat,
N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,
20 1-(2,4-Dichlorophenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim,
N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid,
cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl]-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholinhydrochlorid,
1-(3,5-Dichlorophenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion,
1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol,
25 1-[2-(4-Chlorophenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol,
Methantetrathiol, -Natriumsalz,
2-(2,3,3-Triiod-2-propenyl)-2H-tetrazol,
N-[3-Chlor-4,5-bis(2-propinyl)oxy]-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid,
 α -(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)- β [(4-(trifluormethyl)-phenyl)-methylen]-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
30 1-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion,
N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid,
3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion,
N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,
N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin, -Natriumsalz,
35 N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-on,
2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyanatomethyl)-acetamid,
Ethyl-[(4-chlorophenyl)-azo]-cyanoacetat,
N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
40 N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzolsulfonamid,
Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,
3-[2-(4-Chlorophenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin,
2-[(1-Methylethyl)sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol,
spiro[2H-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on,
45 Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylicarbonyl)-DL-alaninat,
Kaliumhydrogencarbonat,
1-[2-(4-Dichlorophenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol,
1-[(Diiodmethyl)-sulfonyl]-4-methyl-benzol,
2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril,
50 2-[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl- β -D-glycopyranosyl)- α -D-glucopyranosyl]-amino]-4-methoxy-1H-pyrro-
lo[2,3-d]pyrimidin-5-carbonitri,
Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat,
2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid,
O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat,
55 α -(2,4-Dichlorophenyl)- β -fluor- β -propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
3-(1,1-Dimethylpropyl)-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,
2,6-Dichlor-5-(methylthio)-4-pyrimidinyl-thiocyanat,
S-Methyl-1,2,3-benzothiadiazol-7-carbothioat,
N-(6-Methoxy)-3-pyridinyl)-cyclopropancarboxamid,
60 3,5-Dichlor-N-[cyan[(1-methyl-2-propynyl)oxy]methyl]-benzamid,
4-Chlor-2-cyan-N,N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1H-imidazol-1-sulfonamid,
8-(1,1-Dimethylethyl)-N-ethyl-N-propyl-1,4-dioxaspiro[4.5]decan-2-methanamin,
2,2-Dichlor-N-[1-(4-chlorophenyl)ethyl]-1-ethyl-3-methyl-cyclopropancarboxamid,
N-(2,3-Dichlor-4-hydroxyphenyl)-1-methyl-cyclohexanecarboxamid.
65 Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren ist möglich.
Die erfundungsgemäßen Wirkstoffe können als solche, in Form ihren handelsüblichen Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten,

DE 196 23 744 A1

lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z. B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verschläumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder der Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

Bei der Behandlung von Pflanzenteilen können die Wirkstoffkonzentrationen in den Anwendungsformen in einem größeren Bereich variiert werden: Sie liegen im allgemeinen zwischen 1 und 0,0001 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,5 und 0,001 Gew.-%.

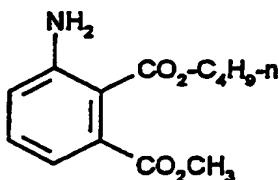
Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 50 g je Kilogramm Saatgut, vorzugsweise 0,01 bis 10 g benötigt.

Bei der Behandlung des Bodens sind Wirkstoffkonzentrationen von 0,00001 bis 0,1 Gew.-%, vorzugsweise von 0,0001 bis 0,02 Gew.-% am Wirkungsort erforderlich.

Herstellungsbeispiele

Beispiel 1)

15



20

Verfahren a)

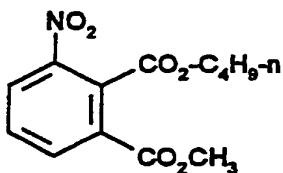
25

Zu einer Suspension von 4,0 g 3-Nitrophthalsäure-1-methylester-2-butylester (14 mMol) und 4,2 g Zinkstaub in einem Gemisch aus 60 ml Wasser und 25 ml Tetrahydrofuran tropft man unter Rühren bei 20°C innerhalb von ca. 20 Minuten 15 ml konzentrierte Salzsäure zu und röhrt anschließend noch 2 Stunden bei 20°C nach. Durch Zugabe von Natriumhydrogencarbonat-Lösung wird der pH-Wert der Reaktionsmischung auf 5–6 eingestellt. Anschließend wird mit Ether extrahiert, die organische Phase mit Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und bei verminderter Druck eingeengt. Der Rückstand wird mit Ether an Kieselgel chromatografiert.

Man erhält 2,9 g (82,4% der Theorie) 3-Aminophthalic acid-1-methylester-2-butylester als hellgelbes Öl mit einem Brechungsindex von $n_D^{20} = 1,5403$.

Herstellung des Ausgangsstoffes

40



45

4,1 g (15 mMol) 3-Nitrophthalsäure-2-butylester und 2,2 g (18 mMol) Dimethylformamiddimethylacetal werden in 40 ml Toluol gelöst und 12 Stunden unter Rückfluß geführt. Die Reaktionslösung wird abgekühlt, zuerst mit Natriumhydrogencarbonatlösung und anschließend mit Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und bei verminderter Druck bei 60°C eingeengt.

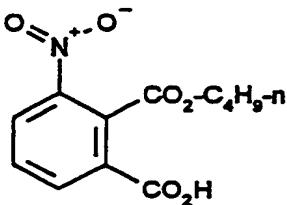
Man erhält 3,9 g (92% der Theorie) 3-Nitrophthalic acid-1-methylester-2-butylester als hellgelbes Öl.
1H-NMR (CDCl3/TMS): 3,95 ppm (s, 3H).

50

55

Herstellung des Vorproduktes

60



65

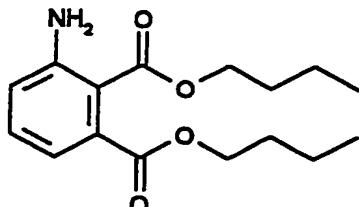
DE 196 23 744 A1

5 Eine Lösung von 12 g 3-Nitrophthalsäureanhydrid (Org. Synth. Coll. Vol. I, 410 [1941]) (6,2 mMol) in 80 ml n-Butanol, wird unter Röhren 7 Stunden auf 100°C erhitzt. Das Lösungsmittel wird bei verminderem Druck bei 60°C abdestilliert, der Rückstand mit Petrolether verrührt. Das Produkt wird über eine Fritte abgesaugt und im Vakuum bei 50°C getrocknet.

- 5 Man erhält 14,6 g (88,1% der Theorie) 3-Nitrophthalsäure-2-butylester als farblose Kristalle vom Schmelzpunkt 137°C.

Beispiel 2

10



15

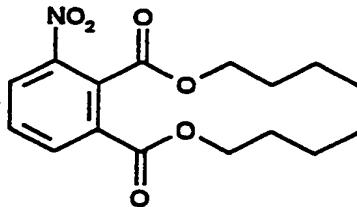
20

Verfahren a)

25 16,0 g (0,049 Mol) 3-Nitrophthalsäuredibutylester und 14,5 g Zinkstaub werden in einem Gemisch aus 220 ml Wasser und 85 ml Tetrahydrofuran gelöst. Bei 20°C lässt man langsam 54 ml konzentrierte Salzsäure zutropfen und röhrt 2 Stunden bei 20°C. Die Reaktionsmischung wird mit Ether extrahiert, die organische Phase mit Wasser versetzt und mit Natriumhydrogencarbonat-Lösung auf einen pH-Wert von 6 eingestellt. Die Phasen werden getrennt, die organische Phase mit Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und bei verminderem Druck eingeengt. Der Rückstand wird mit Cyclohexan/Essigester (3 : 1) an Kieselgel chromatografiert. Man erhält 10,8 g (75,1% der Theorie) 3-Aminophthalsäuredibutylester als hellgelbes Öl mit einem Brechungsindex von $n_D^{20} = 1,5251$.

Herstellung des Ausgangsstoffes

35



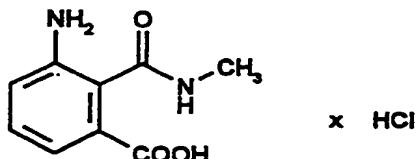
40

45

50 10,4 g (0,049 Mol) 3-Nitrophthalsäure und 25,0 g (0,123 Mol) Dimethylformamiddibutylacetal werden in 125 ml Toluol gelöst und 10 Stunden unter Rückfluß geröhrt. Nach dem Abkühlen wird die Reaktionsmischung mit Wasser gewaschen, die organische Phase abgetrennt, über Natriumsulfat getrocknet und bei verminderem Druck eingeengt. Man erhält 15,1 g (95,5% der Theorie) 3-Nitrophthalsäuredibutylester als hellbraunes Öl.
 $^1\text{H-NMR}$ [CDCl₃/TMS]: 4,35 ppm (t , 2H), 4,43 ppm (t , 2H).

Beispiel 3

55



60

Verfahren a)

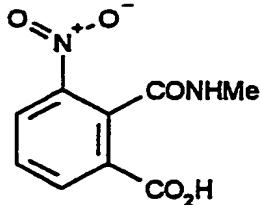
65 39,0 g (0,174 Mol) 3-Nitrophthalsäure-2-methylamid und 5 g Raney-Nickel werden in 200 ml Methanol vorgelegt. Bei 50°C wird Wasserstoff mit 40–50 bar über einen Zeitraum von 4 Stunden aufgedrückt. Nach dem Abkühlen wird die Reaktionsmischung filtriert und das Filtrat bei verminderem Druck eingeengt. Der Rückstand wird in Tetrahydrofuran aufgenommen, mit etherischer Salzsäure im Überschuß versetzt, das kristallisiert.

DE 196 23 744 A1

rende Hydrochlorid abgesaugt und bei verminderter Druck bei 50°C getrocknet.
Man erhält 25,1 g (62,6% der Theorie) 3-Aminophthalsäure-2-methylamidhydrochlorid.
¹H-NMR (D₂O/TMS): 2,60 ppm (3 H).

Herstellung des Ausgangsstoffes

5



10

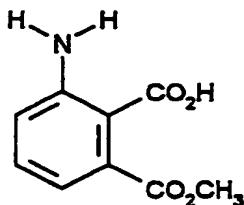
15

Zu 38,6 g (0,2 Mol) 3-Nitrophthalsäureanhydrid in 50 ml Wasser lässt man 22,0 g Methylamin (35%-ige wäßrige Lösung) bei 20°C zutropfen und führt noch 6 Stunden bei 70°C. Der nach dem Abkühlen ausfallende Niederschlag wird abgesaugt und bei 50°C im Vakuum getrocknet.
Man erhält 39,0 g (87% der Theorie) 3-Nitrophthalsäure-2-methylamid.
¹H-NMR (DMSO/TMS): δ = 2,37 ppm.

20

Beispiel 4

25



30

35

Verfahren a)

130 g (0,58 Mol) 3-Nitrophthalsäure-1-methylester (J. Amer. Chem. Soc., (1909) 486) werden unter Zusatz von 10 g Raney-Nickel bei einer Temperatur von 40°C und einem Druck von 50 bar mit Wasserstoff katalytisch reduziert. Der Katalysator wird abfiltriert und das Filtrat bei verminderter Druck eingeengt. Der Rückstand wird mit Ether an Kieselgel chromatografiert.

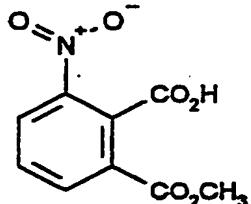
40

Man erhält 25,2 g (22,3% der Theorie) 3-Aminophthalsäure-1-methylester als hellgelbes Öl.

¹H-NMR: 3,85 ppm (s [3H]/CDCl₃).

Herstellung des Vorproduktes

45



50

55

45,2 g (0,21 Mol) 3-Nitrophthalsäure und 27 g konzentrierte Schwefelsäure werden in 450 ml Methanol gelöst und 24 Stunden unter Rückfluß geröhrt. Nach dem Abkühlen wird der Ansatz unter Röhren in Wasser gegeben. Der ausgefallene Niederschlag wird abgesaugt und bei verminderter Druck bei 50°C getrocknet.
Man erhält 39,0 g (82,5% der Theorie) 3-Nitrophthalsäure-1-methylester als farblose Kristalle vom Schmelzpunkt 146°C (Org. Synth., Coll. Vol. I, 408 [1941]).

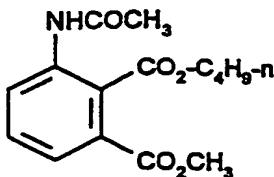
60

65

Beispiel 5

5

10



Verfahren b)

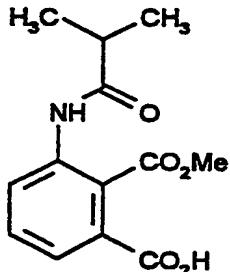
In eine Lösung von 2,1 g (8,4 mMol) 3-Aminophthalsäure-1-methylester-2-butylester und 0,84 g (8,4 mMol) Triethylamin in 40 ml Toluol lässt man 0,66 g (8,4 mMol) Acetylchlorid, gelöst in 5 ml Toluol, eintropfen. Nach Beendigung der Zugabe lässt man 2 Stunden bei 50°C nachröhren. Zur Aufarbeitung wird auf 20°C abgekühlt, die Reaktionsmischung mit Wasser gewaschen, die organische Phase über Natriumsulfat getrocknet und bei verminderter Druck eingeengt. Der Rückstand wird mit Ether an Kieselgel chromatografiert.
 Man erhält 1,8 g (73,1% der Theorie) 3-Acetylaminophthalsäure-1-methylester-2-butylester als farbloses Öl mit einem Brechungsindex von $n_D^{20} = 1,5273$.

Beispiel 6

25

30

35



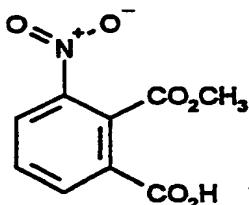
Verfahren c)

74 g (0,329 Mol) 3-Nitrophthalsäure-2-methylester und 150 ml Isobuttersäureanhydrid werden in 500 ml Methanol gelöst und mit 8 g Palladium auf Aktivkohle (5%-ig) versetzt. Bei 20°C wird 5 Stunden lang Wasserstoff mit einem Druck von 3–5 bar aufgedrückt. Die Reaktionsmischung wird entspannt, dann filtriert und das Filtrat bei verminderter Druck eingeengt. Der Rückstand wird aus Diisopropylether umkristallisiert.
 Man erhält 53,8 g (61,6% der Theorie) 3-(2-Methylpropionylamino)-phthalsäure-2-methylester, vom Schmelzpunkt 137–139°C.

Herstellung des Ausgangsstoffes

50

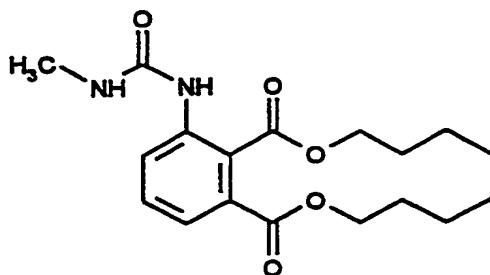
55



26,0 g (0,135 Mol) Nitrophthalsäureanhydrid werden in 200 ml Methanol gelöst und 8 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Das Lösungsmittel wird bei verminderter Druck abdestilliert und der Rückstand mit Petrolether verrührt und anschließend abgesaugt. Man erhält 28,8 g (95% der Theorie) 3-Nitrophthalsäure-2-methylester.
¹H-NMR [DMSO/TMS]: 3,85 ppm (s, 3H).

65

Beispiel 7

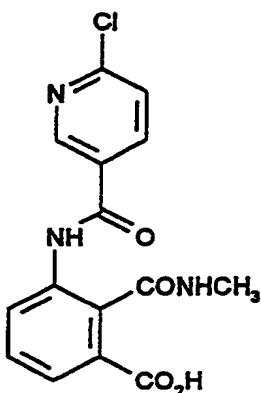


Verfahren d)

3,3 g (0,011 Mol) 3-Aminophthalsäuredibutylester, 0,74 g (0,013 Mol) Methylisocyanat und 0,3 ml Triethylamin werden in 30 ml Toluol gelöst und 8 Stunden bei 60°C gerührt. Nach dem Abkühlen wird die Reaktionsmischung mit Wasser gewaschen, die organische Phase abgetrennt, über Natriumsulfat getrocknet und bei verminderter Druck eingeengt. Der Rückstand wird mit Ether an Kieselgel chromatografiert. Man erhält 2,3 g (59,7% der Theorie) 3-(Methylaminocarbonylamino)phthalsäuredibutylester mit einem Brechungsindex von $n_D^20 = 1,5278$.

20

Beispiel 8

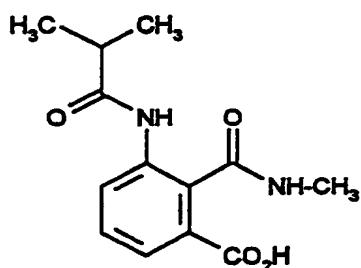


Verfahren e)

4,6 g (0,02 Mol) 3-Aminophthalsäure-2-methylhydrochlorid und 4,4 g (0,044 Mol) Triethylamin werden in 50 ml Acetonitril gelöst. Bei 20°C lässt man eine Lösung von 3,5 g (0,02 Mol) 6-Chlornicotinsäurechlorid in 20 ml Acetonitril zutropfen. Es wird noch 2 Stunden bei 20°C gerührt. Die Reaktionsmischung wird mit Wasser versetzt und mit Essigsäureethylester extrahiert. Die organische Phase wird über Natriumsulfat getrocknet und bei verminderter Druck eingeengt. Der Rückstand wird mit Essigsäureethylester an Kieselgel chromatogra- 50

fiiert.
Man erhält 4,35 g (65,2% der Theorie) 3-(6-Chlornicotinoylamino)phthalsäure-2-methylamid als zähes Öl.
¹H-NMR (DMSO): 2,09 ppm (3H).

Beispiel 9



DE 196 23 744 A1

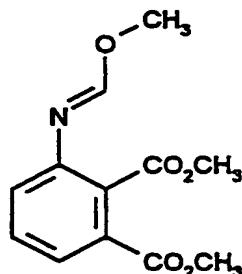
Verfahren f)

4,6 g (0,02 Mol) 3-Aminophthalsäure-2-methylamidhydrochlorid und 4,4 g (0,044 Mol) Triethylamin werden in 50 ml Acetonitril gelöst. Man läßt bei 20°C eine Lösung von 2,2 g (0,021 Mol) Isobuttersäurechlorid in 10 ml Acetonitril zutropfen und röhrt noch 2 Stunden bei 20°C. Die Reaktionsmischung wird mit Wasser verrührt und mit Essigsäureethylester extrahiert. Die organische Phase wird über Natriumsulfat getrocknet und bei verminderterem Druck eingeengt.
 5 Man erhält 2,1 g (39% der Theorie) 3-(2-Methylpropionylamino)phthalsäure-2-methylamid als hellgelbes Öl.
 NMR (CDCl_3/TMS): $\delta = 1,31; 1,34 \text{ ppm}$

10

Beispiel 10

15



20

25

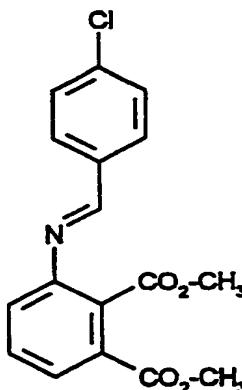
Verfahren g)

3,9 g 3-Aminophthalsäure-1-methylester (20 mMol) und 2,4 g (22 mMol) ortho-Ameisensäure-trimethylester werden in 6,2 g (60 mMol) Acetanhydrid gelöst, unter Röhren auf 140°C erwärmt und 7 Stunden bei dieser Temperatur weitergeführt. Nach dem Abkühlen wird unter kräftigem Röhren mit Wasser versetzt und der ausfallende Niederschlag über eine Nutsche abgesaugt. Das Rohprodukt wird in Chloroform gelöst, über Natriumsulfat getrocknet und bei verminderterem Druck eingeengt. Der Rückstand wird in Diisopropylether verrührt, abgesaugt und bei verminderterem Druck bei 50°C getrocknet.
 30 Man erhält 3,1 g (65,4% der Theorie) 3-Methoxymethyleneaminophthalsäuredimethylester als farblose Kristalle.
 35 $^1\text{H-NMR}$: 2,19 ppm (s, [3H]/ CDCl_3)

40

Beispiel 11

45



50

55

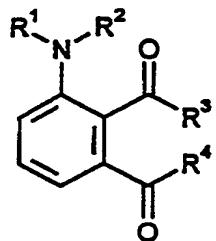
Verfahren g)

60 5,0 g (0,024 Mol) 3-Aminophthalsäuredimethylester (J. Amer. Chem. Soc., (1937) 2580—3), 6,7 g (0,048 Mol) 4-Chlorbenzaldehyd und 0,5 g (0,0024 Mol) Toluolsulfinsäure werden in 100 ml Toluol gelöst und 4 Stunden unter Rückfluß zum Sieden erhitzt. Zur azeotropen Entfernung von Reaktionswasser wird die Hälfte des Lösungsmittels innerhalb von weiteren 4 Stunden abdestilliert. Nach dem Abkühlen wird die Lösung mit Wasser gewaschen und über Natriumsulfat getrocknet. Das Lösungsmittel wird bei verminderterem Druck abdestilliert und der Rückstand mit Cyclohexan/Essigester (3 : 1) an Kieselgel chromatografiert.
 65 Man erhält 4,4 g (55% der Theorie) 3-(4-Chlorbenzylideneamino)phthalsäuredimethylester als hellgelbe Kristalle vom Schmelzpunkt 84—85 °C.

Analog den Beispielen 1—11, sowie entsprechend den allgemeinen Beschreibungen der Verfahren a) bis g)

DE 196 23 744 A1

wurden die in der nachfolgenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen erhalten.



I-g

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

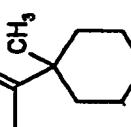
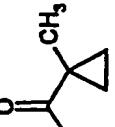
55

60

65

Tabelle 1

Bsp.-Nr	R ²	R ¹	R ³	R ⁴	Herstellverfahren F (°C)	n _D ²⁰	NMR*
12	-COCH ₃	-H	-OH	-O-CH ₃	c		3,80 (3H), (DMSO)
13	-H	-H	-O-CH ₃	-OH	a	80	
14	-COCH ₃	-H	-O-CH ₃	-OH	b	~85	
15	-COPh	-H	-O-CH ₃	-OH	b	92	
16	-CO-n-Butyl	-H	-O-CH ₃	-OH	b		3,85 (3H), (CDCl ₃)
17	-CO-n-Propyl	-H	-O-CH ₃	-OH	b		3,86 (3H), (CDCl ₃)
18	-CO-i-Propyl	-H	-OH	-O-CH ₃	c		1,26 (3H), 1,29 (3H), (CDCl ₃)

Bsp-Nr	R ²	R ¹	R ³	R ⁴	Herstellverfahren	F (°C)	n_{D}^{20}	NMR*
19	-CO-n-Propyl	-H	-OH	-O-CH ₃	c			
20	-CO-Cyclopropyl	-H	-OH	-O-CH ₃	b			3,90 (3H), (CDCl ₃)
21	-CO-Cyclopropyl	-H	-O-CH ₃	-OH	b	142		3,91 (3H), (CDCl ₃)
22		-H	-O-CH ₃	-OH	b			1,25 (3H), (CDCl ₃)
23		-H	-O-CH ₃	-OH	b			3,90 (3H), (CDCl ₃)
24	-CO-Benzyl	-H	-O-CH ₃	-OH	b			3,68 (3H), (CDCl ₃)

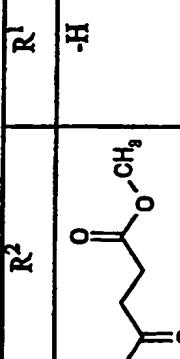
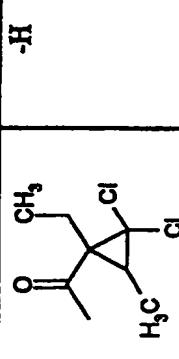
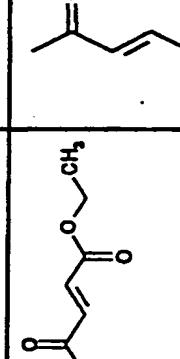
5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55
60
65

Bsp.-Nr.	R ²	R ¹	R ³	R ⁴	Herstellverfahren F (°C)	δ_D^{20}	NMR*
25		-H	-O-CH ₃	-OH	b		
26		-H	-O-CH ₃	-OH	e	3,89 (3H), (CDCl ₃)	
27		-H	-O-CH ₃	-OH	e	2,46 (3H), (CDCl ₃)	
28		-H	-O-CH ₃	-OH	e	3,96 (3H), (CDCl ₃)	

Bsp.-Nr	R ²	R ¹	R ³	R ⁴	Herstellverfahren	F (°C)	η_{D}^{20}	NMR*
29		-H	-OH	-O-CH ₃	b			
30	-CO-Benzyl	-H	-OH	-O-CH ₃	b			3,69 (3H), (CDCl ₃)
31		-H	-OH	-O-CH ₃	e			2,62 (3H), (CDCl ₃)
32		-H	-OH	-O-CH ₃	b			1,23 (3H), (CDCl ₃)

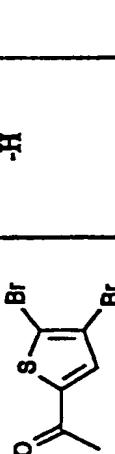
5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55
60
65

Bsp-Nr	R ²	R ¹	R ³	R ⁴	Herstellverfahren F (°C)	n _D ²⁰	NMR*
33		-H	-OH	-O-CH ₃	b		3,70 (3H), (CDCl ₃)
34	-H		-OH	-OH	a		
35		-H	-OH	-O-CH ₃	e		3,93 (3H), (CDCl ₃)
36	-COPh	-H	-OH	-OH	b	157	
37		-H	-OH	-O-CH ₃	e		3,89 (3H), (CDCl ₃)
38	-H		-	-O-CH ₃	-O-CH ₃	a	1,5613

Bsp.-Nr	R ²	R ¹	R ³	R ⁴	Herstellverfahren	F (°C)	n _D ²⁰	NMR*
39		-H	-O-CH ₃	-OH	b			3,99 (3H), (DMSO)
40		-H		-O-CH ₃	b			5,39 (1H), (CDCl ₃)
41				-OH	-O-CH ₃	b		3,81 (3H), (CDCl ₃)

5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55
60
65

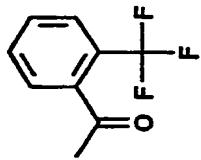
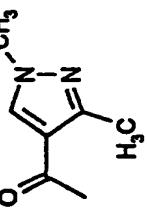
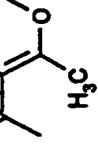
Bsp-Nr	R ²	R ¹	R ³	R ⁴	Herstellverfahren	F (°C)	η_D^{20}	NMR*
42		-H	-O-CH ₃	-OH	b			3,78 (3H), (CDCl ₃)
43	-COCH ₃	-H	-O-CH ₃	-O-CH ₃	b	79-80		
44	-COCH ₃	-H	-OH	-OH	b	180		
45	-COPh	-H	-O-CH ₃	-O-CH ₃	b		1,585	
46	-CO-i-Propyl	-H	-OH	-OH	b			1,21 (3H), 1,24 (3H), (CDCl ₃)
47		-H	-OH	-OH	d			
48		-H	-OH	-OH	e	221		13,66 (2H), (DMSO)

Bsp-Nr	R ²	R ¹	R ³	R ⁴	Herstellverfahren	F (°C)	n _D ²⁰	NMR*
49	-CO-NH-CH ₃	-H	-OH	-O-CH ₃	d			2,68 (3H), (CDCl ₃)
50		-H	-OH	-OH	e			
51	-COPh	-H	-NH-CH ₃	-OH	f			2,51; (DMSO)
52	-CO-NH-CH ₃	-H	-OH	-OH	d			2,50; (DMSO)
53	-CO-NH-i-Propyl	-H	-OH	-OH	d	127		0,99 (3H), 1,01 (3H), (DMSO)
54	-H	-H	-O-nPr	-O-nPr	a			1,5334
55	-H	-H	-O-nPr	-OH	a	99		
56	-H	-H	-O-iPr	-OH	a	126- 128		
57	-H	-H	-n-Butoxy	-OH	a		1,5563	

5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55
60
65
70

Bsp-Nr	R ²	R ¹	R ³	R ⁴	Herstell-verfahren	F (°C)	n _D ²⁰	NMR*)
58	-H	-H	-O-Cyclohexyl	-OH	a	97-99		
59	-COCH ₃	-H	-O-nPr	-O-nPr	b	68		
60	-CO-NH-CH ₃	-H	-O-nPr	-O-nPr	d	1,5162		
61	-COCH ₃	-H	-n-Butoxy	-n-Butoxy	b	1,5171		
62		-H	-n-Butoxy	-n-Butoxy	d	93-95		
63	-COOC ₂ H ₅	-H	-O-CH ₃	-O-CH ₃	b	60-61		
64	-COCH ₃	-H	-n-C ₁₂ H ₂₅	-OH	b	88		
65	-COCH ₃	-H	-O-Cyclohexyl	-OH	b	56-58		
66	-H		-O-CH ₃	-N(CH ₃) ₃	a	128-130		
67		-H	-O-CH ₃	-O-CH ₃	b	94-98		

Bsp.-Nr.	R ²	R ¹	R ³	R ⁴	Herstellverfahren	F (°C)	n_D^{20}	NMR*)
68		-H	-O-CH ₃	-O-CH ₃	e	139-141		
69		-H	-O-CH ₃	-O-CH ₃	e	131-133		

Bsp-Nr	R ²	R ¹	R ³	R ⁴	Herstellverfahren	F (°C)	n _D ²⁰	NMR*)
70		-H	-O-CH ₃	-O-CH ₃	b	110-112		
71		-H	-O-CH ₃	-O-CH ₃	e	105-106		
72		-H	-O-CH ₃	-O-CH ₃	e	96-98		

Bsp-Nr	R ²	R ¹	R ³	R ⁴	Herstellverfahren	F (°C)	n _D ²⁰	NMR*
73		-H	-O-CH ₃	-O-CH ₃	b	75-78		
74			-O-CH ₃	-O-CH ₃	b	100-102		
75	=CH-N(CH ₃) ₂		-O-CH ₃	-O-CH ₃	g		3,85 (3H), (CDCl ₃)	
76			-OH	-O-CH ₃	g		3,23 (3H), (CDCl ₃)	

- *) Das ¹H-NMR-Spektrum wurde in Deuterchloroform (CDCl₃) oder Hexa-deuterodimethylsulfoxid (DMSO-d₆) mit Tetramethylsilan (TMS) als innerem Standard aufgenommen. Angegeben ist die chemische Verschiebung als d-Wert in ppm.

Beispiel A

Plasmopara-Test (Reben)/protektiv

Lösungsmittel: 4,7 Gewichtsteile Aceton
Emulgator: 0,3 Gewichtsteile Alkylaryl/polyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtteil Wirkstoff mit den

DE 196 23 744 A1

angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wäßrigen Sporensuspension von *Plasmopara viticola* inkuliert und verbleiben dann 1 Tag in einer Feuchtkammer bei 20 bis 22°C und 100% relativer Luftfeuchtigkeit. Anschließend werden die Pflanzen 5 Tage im Gewächshaus bei 21°C und ca. 90% Luftfeuchtigkeit aufgestellt. Die Pflanzen werden dann angefeuchtet und 1 Tag in eine Feuchtkammer gestellt.

6 Tage nach der Inkulation erfolgt die Auswertung.

Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele (4), (6), (13) und (15) bei einer beispielhaften Wirkstoffkonzentration von 100 ppm einen Wirkungsgrad bis zu 97% im Vergleich zur unbehandelten Kontrolle.

Beispiel B

15 Botrytis-Test (Bohne)/protektiv

Lösungsmittel: 4,7 Gewichtsteile Aceton
Emulgator: 0,3 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

20 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden auf jedes Blatt 2 kleine mit *Botrytis cinerea* bewachsene Agarstückchen aufgelegt. Die inkulierten Pflanzen werden in einer abgedunkelten, feuchten Kammer bei 20°C aufgestellt. 3 Tage nach der Inkulation wird die Größe der Befallsflecken auf den Blättern ausgewertet.

Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele (4), (6), (13), (14), (15), (16) und (17) bei einer beispielhaften Wirkstoffkonzentration von 100 ppm einen Wirkungsgrad bis zu 98%.

30 Beispiel C

Pseudocercospora herpotrichoides-Test (Weizen)/protektiv

Lösungsmittel: 10 Gewichtsteile N-Methyl-pyrrolidon
Emulgator: 0,6 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

40 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit besprüht man junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge.

Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen an der Halmbasis mit Sporen von *Pseudocercospora herpotrichoides* inkuliert.

45 Die Pflanzen werden in einem Gewächshaus bei einer Temperatur von ca. 10°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 80% aufgestellt.

21 Tage nach der Inkulation erfolgt die Auswertung.

Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen (4) und (14) der Herstellungsbeispiele bei einer beispielhaften Wirkstoffkonzentration in der Spritzbrühe von 250 ppm Wirkungsgrad von 100% im Vergleich zur unbehandelten Kontrolle.

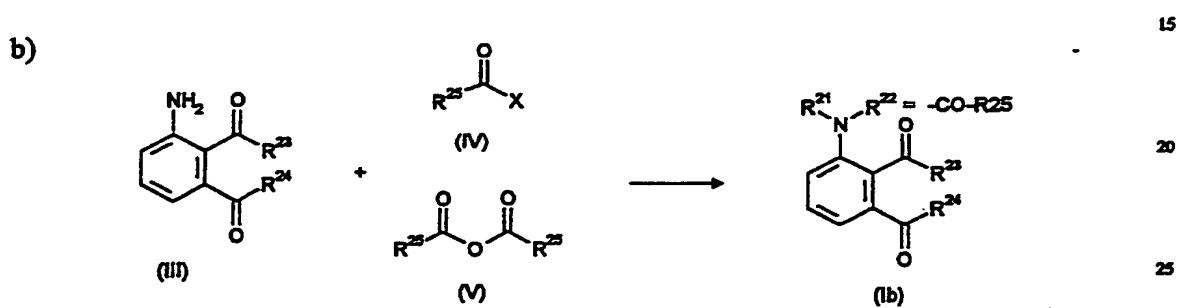
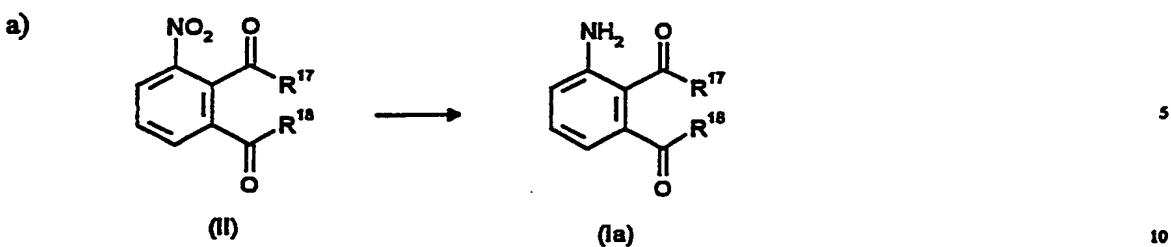
50 Anhang: Verfahren:

55

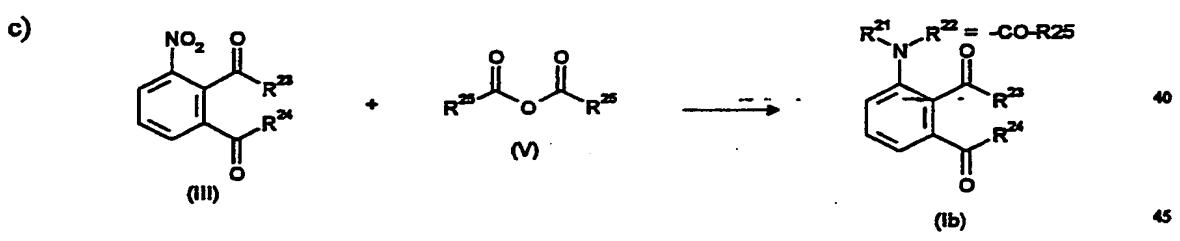
60

65

DE 196 23 744 A1

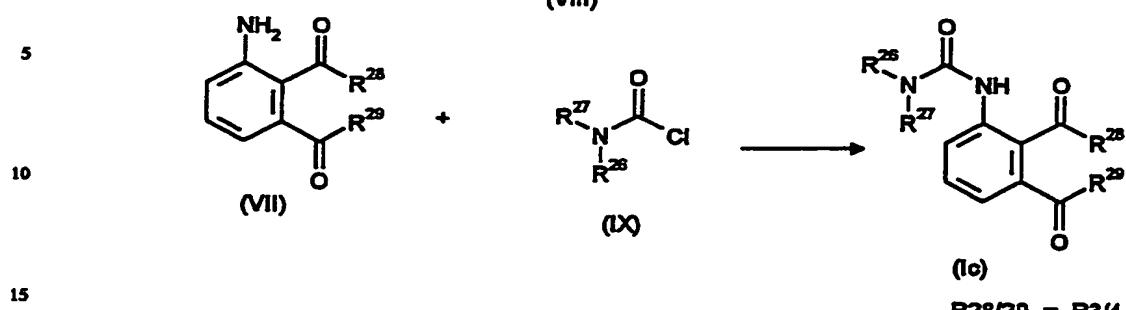


R23 und R24 = nur Alkoxy oder
nicht gleichzeitig Hydroxy



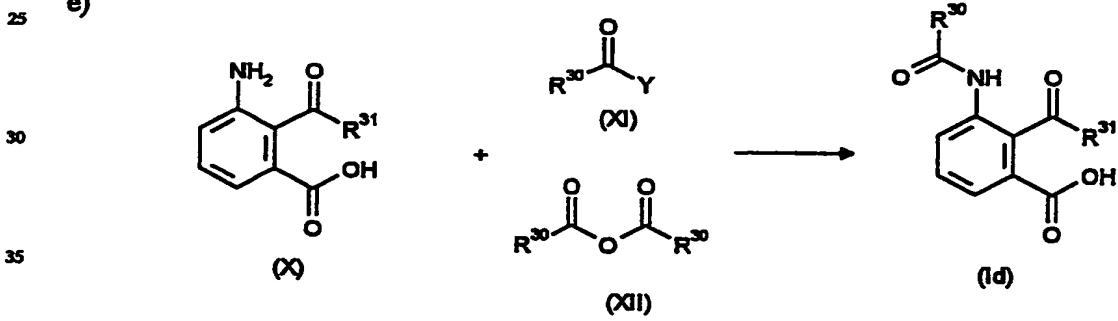
R23 und R24 = nur Alkoxy oder
nicht gleichzeitig Hydroxy

d)



20

25



40

45

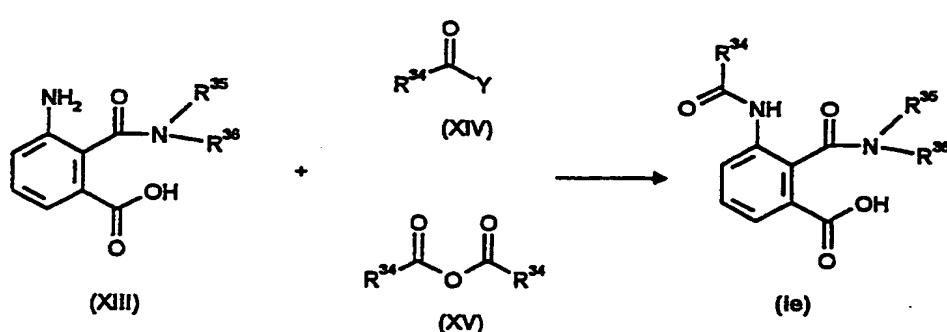
50

55

60

66

f)



5

10

15

20

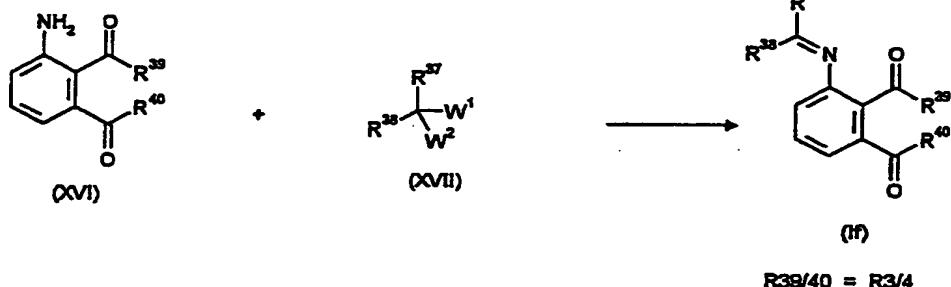
25

30

35

40

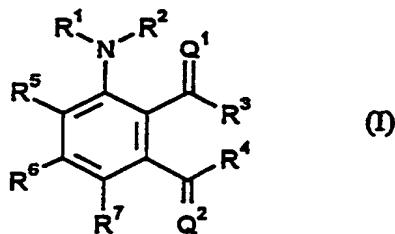
g)



35

Patentansprüche

1. Verwendung von Verbindungen der Formel (I),

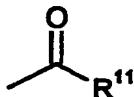


45

50

55

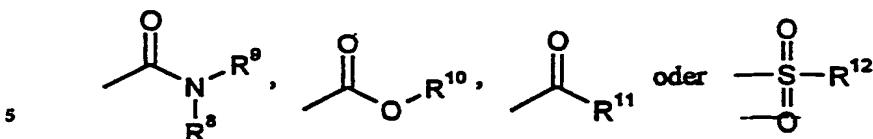
in welcher
 Q^1 und Q^2 gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Sauerstoff oder Schwefel stehen,
 R^1 für Wasserstoff oder die Gruppierung



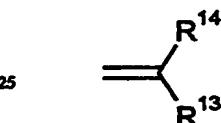
60

steht,
worin R^{11} die unten angegebene Bedeutung hat,
 R^2 für Wasserstoff oder eine der nachfolgenden Gruppierungen

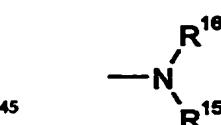
65



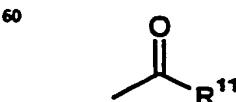
10 steht,
10 worin
10 R^8 für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,
10 R^9 für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder
10 R^8 und R^9 gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclen stehen,
15 R^{10} für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Aryl oder Cycloalkyl substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl oder für Heterocyclen steht,
15 R^{11} für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Aryl, Arylalkyl oder Heterocyclen steht,
15 R^{12} für Alkyl, Aryl oder Heterocyclen steht, oder
20 R^1 und R^2 gemeinsam für eine Gruppierung



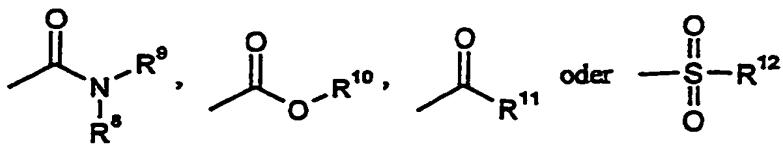
30 stehen, worin
30 R^{13} für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl oder gegebenenfalls substituiertes Heterocyclen steht und
30 R^{14} für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Aryl, Heterocyclen, Alkoxy oder Dialkylamino steht oder
35 R^{13} und R^{14} gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cycloalkylen stehen, oder
35 R^1 und R^2 gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclen stehen,
40 R^3 und R^4 gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Arylalkoxy, Cycloalkoxy, Cycloalkenyloxy, Aryloxy, Heterocyclyloxy, Mercapto, Alkylothio, Alkenylothio, Alkinylothio, Arylalkylothio, Cycloalkylothio, Cycloalkenylothio, Arylothio, Heterocyclylothio oder



50 stehen, wobei
50 R^{15} für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,
50 R^{16} für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder
50 R^{15} und R^{16} gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclen stehen und
55 R^5 , R^6 und R^7 gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl, Alkoxy, Alkylothio, Halogenalkyl, Halogenalkoxy oder Halogenalkylothio stehen,
55 zur Bekämpfung von Schädlingen.
55 2. Verwendung der Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher
55 Q^1 und Q^2 gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Sauerstoff oder Schwefel stehen,
55 R^1 für Wasserstoff oder die Gruppierung



65 steht, worin R^{11} die unten angegebene bevorzugte Bedeutung hat, steht,
65 R^2 für Wasserstoff oder eine der nachfolgenden Gruppierungen



5

steht, worin

R^8 für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1-5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,

R^9 für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder

R^8 und R^9 gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen,

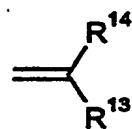
R^{10} für gegebenenfalls durch Phenyl oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkinyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen oder für Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,

R^{11} für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Alkoxy carbonyl, Alky carbonyl oder Carboxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkinyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen oder Halogen substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Aryl, Arylalkyl oder Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,

R^{12} für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Phenyl, Naphthyl oder Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht, oder

R^1 und R^2 gemeinsam für eine Gruppierung

30



35

stehen, worin

R^{13} für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl, Alkoxy, Halogen, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht und

R^{14} für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenyl, Naphthyl, Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern, Alkoxyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylteilen steht oder

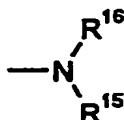
R^{13} und R^{14} gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cycloalkyliden mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen stehen, oder

R^1 und R^2 gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen,

45

R^3 und R^4 gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkinyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Phenylalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkoxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyloxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenoxy, Heterocyclyoxy mit 3 bis 7 Ringgliedern, Mercapto, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenylthio mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkinylthio mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Arylalkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkylthio mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenythio mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenylthio, Heterocyclthio mit 3 bis 7 Ringgliedern oder

50



55

stehen, wobei

R^{15} für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,

60

DE 196 23 744 A1

Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1–5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,
 R¹⁶ für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder

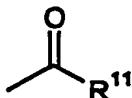
R¹⁵ und R¹⁶ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen, und

R⁵, R⁶ und R⁷ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkythio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl, Halogenalkoxy oder Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen stehen.

3. Verwendung der Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

Q¹ und Q² gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Sauerstoff oder Schwefel stehen, R¹ für Wasserstoff oder die Gruppierung

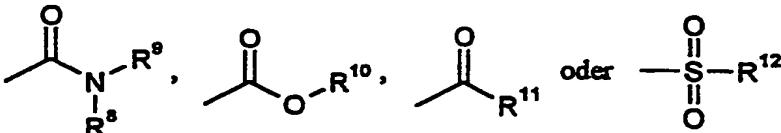
15



20

steht,
 worin R¹¹ die unten angegebene, besonders bevorzugte Bedeutung hat, steht,
 R² für Wasserstoff oder eine der nachfolgenden Gruppierungen

25



30

steht, worin

R⁸ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy oder Difluorchlormethoxy, substituiertes Phenyl, Naphthyl, Thienyl, Pyridyl oder Furyl steht,

R⁹ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht, oder

R⁸ und R⁹ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl oder Piperazinyl stehen,

R¹⁰ für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Benzyl, 1-Phenylethyl, 2-Phenylethyl, Cyclohexylmethyl, Allyl, Propargyl, Oxethan-3-yl steht,

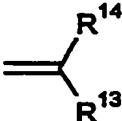
R¹¹ für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Acetyl oder Carboxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Vinyl, Allyl, Propargyl, Penta-1,3-dien-1-yl oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Thienyl, Furyl, Pyrazolyl, Pyridyl oder 2,3-Dihydro[1,4]oxathiin steht,

R¹² für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Phenyl, Naphthyl, Thienyl, Furyl oder Pyridyl steht, oder

50

R¹ und R² gemeinsam für eine Gruppierung

55



stehen, worin

R¹³ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Vinyl, Allyl, Propargyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Phenyl, Methylphenyl, Fluorophenyl, Chlorophenyl, Bromphenyl, Cyanphenyl, Methoxyphenyl, Nitrophenyl, Thienyl, Furyl, Pyridyl oder Chloropyridyl steht und

R¹⁴ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Allyl, Propargyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl, Thienyl, Furyl oder Pyridyl, Methoxy, Ethoxy, Dimethylamino, Diethylamino steht oder

R¹³ und R¹⁴ gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cyclopropyliden, Cyclobutyliden, Cyclopentyliden oder Cyclohexyliden stehen, oder

DE 196 23 744 A1

R¹ und R² gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, PiperidyI, Morpholinyl, Piperazinyl oder Succinimidyl stehen, R³ und R⁴ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Pentoxy, Hexyloxy, Heptyloxy, Octyloxy, Nonyloxy, Decyloxy, Undecyloxy, Dodecyloxy, Allyloxy, Propargyloxy, Benzyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclohexenyloxy, Phenoxy, Oxetan-3-yloxy, Mercapto, Methylthio, Ethylthio, Allylthio, Propargylthio, Benzylthio, Cyclopentylthio, Cyclohexylthio, Cyclohexenylylthio, Phenylthio, Amino, Methylamino, Ethylamino, Dimethylamino, Phenylamino oder über ein Stickstoffatom gebundenes, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, PiperidyI, Morpholinyl oder Piperazinyl stehen und R⁵, R⁶ und R⁷ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluorchloromethoxy, Trifluormethylthio, Difluormethylthio, Difluorchloromethylthio stehen.

4. Verbindungen der Formel (I-a),

5

10

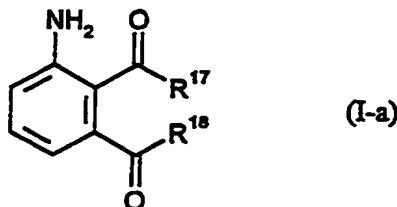
15

20

25

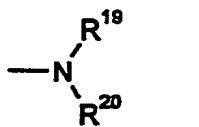
30

35



in welcher

R¹⁷ und R¹⁸ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Arylalkoxy, Cycloalkoxy, Cycloalkenyloxy, Aryloxy, Heterocyclyoxy oder



stehen, wobei

R¹⁹ für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,

R²⁰ für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder

R¹⁹ und R²⁰ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclen steht,

wobei die Verbindungen

3-Aminophthalsäuredimethylester,

3-Aminophthalsäurediethylester,

3-Aminophthalsäuredi-n-propylester,

3-Aminophthalsäure-1-methylester,

3-Aminophthalsäure-2-methylester,

3-Aminophthalsäure,

3-Aminophthalimid,

2-(N-Methyl-N-phenyl-carbamoyl)-6-amino-benzanilid,

1,2-Bis-(N-methyl-N-phenyl-carbamoyl)-3-amino-benzol und

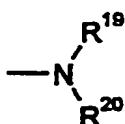
2-(N-Methyl-N-phenyl-carbamoyl)-3-carbomethoxy-anilin,

ausgenommen sind.

5. Verbindungen der Formel (I-a) gemäß Anspruch 4, in welcher

R¹⁷ und R¹⁸ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkinyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Phenylalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkoxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyloxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenoxy, Heterocyclyoxy mit 3 bis 7 Ringgliedern, oder

55



60

65

stehen, wobei

R¹⁹ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils

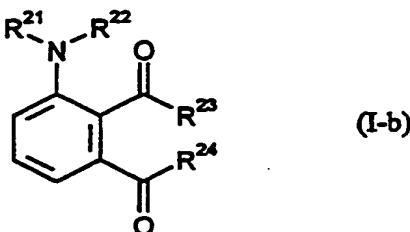
DE 196 23 744 A1

gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1-5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht, R²⁰ für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder

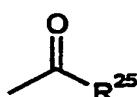
5 R¹⁹ und R²⁰ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen.

6 Verbindungen der Formel (I-a) gemäß Anspruch 4, in welcher
10 R¹⁷ und R¹⁸ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Pentoxy, Hexyloxy, Heptyloxy, Octyloxy, Nonyloxy, Decyloxy, Undecyloxy, Dodecyloxy, Allyloxy, Propargyloxy, Benzyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclohexenylloxy, Phenoxy, Oxetan-3-yloxy, Amino, Methylamino, Ethylamino, Dimethylamino, Phenylamino oder über ein Stickstoffatom gebundenes, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl oder Piperazinyl stehen.

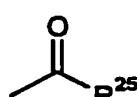
15 7. Verbindungen der Formel (I-b).



in welcher
R²¹ für Wasserstoff oder die Gruppierung



steht, worin R²⁵ die unten angegebene Bedeutung hat,
R²² für die Gruppierung



45 steht, worin
R²⁵ für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkanyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Aryl, Arylalkyl oder Heterocycl steht,

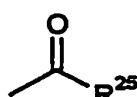
50 R²³ und R²⁴ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Arylalkoxy, Cycloalkoxy, Cycloalkenylloxy, Aryloxy, Heterocyclloxy stehen, wobei R²³ und R²⁴ nicht gleichzeitig für Hydroxy stehen und die Verbindungen

3-Acetylamino-phthalsäuredimethylester und

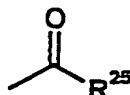
3-Acetylamino-phthalsäure-1-methylester ausgenommen sind.

55 8. Verbindungen der Formel (I-b) gemäß Anspruch 7, in welcher

R²¹ für Wasserstoff oder die Gruppierung



steht,
worin R²⁵ die unten angegebene bevorzugte Bedeutung hat,
R²² für die Gruppierung



5

steht, worin

R²⁵ für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Alkoxy carbonyl, Alkyl carbonyl oder Carboxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkinyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen oder Halogen substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Aryl, Arylalkyl oder Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,

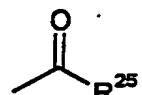
10

R²³ und R²⁴ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Phenylalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkoxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyloxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenoxy, Heterocyclyloxy mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen, wobei R²³ und R²⁴ nicht gleichzeitig für Hydroxy stehen.

15

9. Verbindungen der Formel (I-b) gemäß Anspruch 7, in welcher
R²¹ für Wasserstoff oder die Grundierung

20

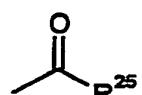


25

steht,

worin R²⁵ die unten angegebene besonders bevorzugte Bedeutung hat,
R²² für die Gruppierung

30



35

steht worin

R²⁵ für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Acetyl oder Carboxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Vinyl, Allyl, Propargyl, Penta-1,3-dien-1-yl oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Thienyl, Furyl, Pyrazolyl, Pyridyl oder 2,3-Dihydro[1,4]oxathiin steht,

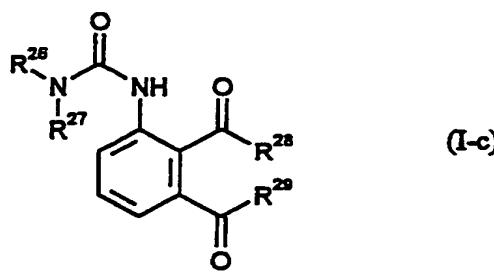
40

R²³ und R²⁴ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Methoxy, Eethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Pentoxy, Hexyloxy, Heptyloxy, Octyloxy, Nonyloxy, Decyloxy, Undecyloxy, Dodecyloxy, Allyloxy, Propargyloxy, Benzyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclohexenyl, Phenoxy oder Oxetan-3-yloxy stehen, wobei R²³ und R²⁴ nicht gleichzeitig für Hydroxy stehen.

45

10. Verbindungen der Formel (I-c),

50



55

60

in welcher

R²⁶ für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,

65

R²⁷ für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder

R²⁶ und R²⁷ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl stehen und

R²⁸ und R²⁹ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy,

Alkinyloxy, Arylalkoxy, Cycloalkoxy, Cycloalkenyloxy, Aryloxy, Heterocyclyoxy stehen.

11. Verbindungen der Formel (I-c) gemäß Anspruch 10, in welcher

R²⁶ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1-5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,

R²⁷ für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder

R²⁶ und R²⁷ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen und

R²⁸ und R²⁹ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Phenylalkoxy mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen im Alkynteil, Cycloalkoxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyloxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen Phenoxy oder Heterocycloxy mit 3 bis 7 Ringgliedern.

12 Verbindungen der Formel (I-c) gemäß Anspruch 10, in welcher

12. Verbindungen der Formel (PC) gemäß Anspruch 10, in welcher R²⁶ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-

R¹- für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder t-Propyl, n-, t-, s- oder t-Butyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Difluormethoxy oder Difluorchlormethoxy, substituierten Phenyl, Naphthyl, Thiienyl, Pyridyl oder Furyl steht.

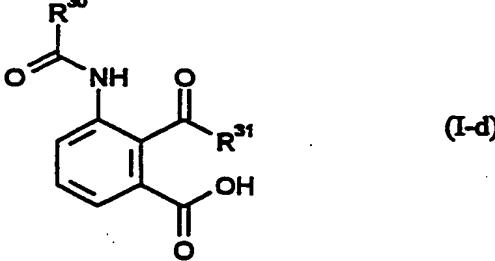
R²⁷ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht oder

R^1 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n - oder t -Propyl, n , m , s oder t -Butyl stehn, oder R^{26} und R^{27} gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolvi, Piperolvi, Morpholinvi oder Piperazinyl stehen und

R²⁸ und R²⁹ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy-, Methoxy-

13. Verbindungen der Formel (I-d).

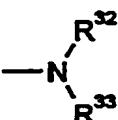
13. Verbindungskette für die (1, 3)



in welcher

R³⁰ für gegebenenfalls substituiertes Heterocycl steht und

R³¹ für Hydroxy oder



steht, wobei

R² für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht, stets, wobei

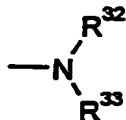
R^{33} für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder

R³² und R³³ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocycl stehen.

14. Verbindungen der Formel (I-d) gemäß Anspruch 13, in welcher

R³⁰ für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen oder Halogen substituiertes Heterocycl mit 3 bis 7

Ringgliedern steht und
 R^{31} für Hydroxy oder



5

steht, wobei

R³² für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1-5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,

10

R³³ für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder

R³² und R³³ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen.

15

15. Verbindungen der Formel (I-d) gemäß Anspruch 13, in welcher

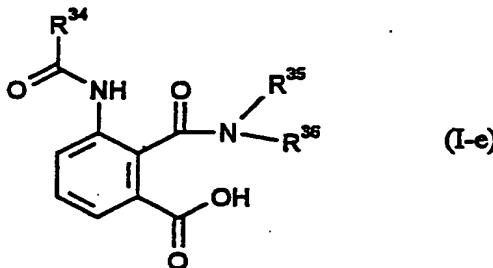
R³⁰ für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Thienyl, Furyl, Pyrazoly, Pyridyl oder 2,3-Dihydro[1,4]oxathiin steht und

20

R³¹ für Hydroxy, Amino, Methylamino, Ethylamino, Dimethylamino, Phenylamino oder über ein Stickstoffatom gebundenes, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl oder Piperazinyl steht.

16. Verbindungen der Formel (I-e),

25



30

35

in welcher

R³⁴ für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl oder Aryl steht,

40

R³⁵ für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Aryl oder Heteroaryl steht,

R³⁶ für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder

R³⁵ und R³⁶ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocycl stehen.

17. Verbindungen der Formel (I-e) gemäß Anspruch 16, in welcher

45

R³⁴ für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Alkoxy carbonyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkinyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen oder Halogen substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Aryl oder Arylalkyl steht,

50

R³⁵ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1-5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,

55

R³⁶ für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder

R³⁵ und R³⁶ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen.

55

18. Verbindungen der Formel (I-e) gemäß Anspruch 16, in welcher

R³⁴ für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Vinyl, Allyl, Propargyl, Penta-1,3-dien-1-yl oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl oder Benzyl steht,

60

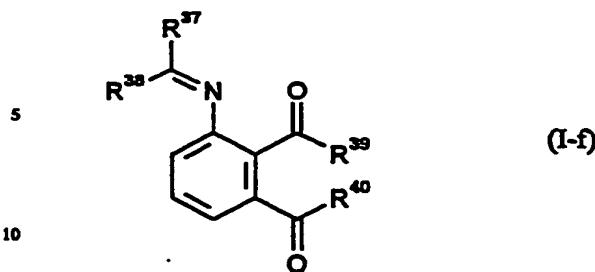
R³⁵ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Phenyl, Cyclopropyl oder Oxethan-3-yl steht,

R³⁶ für Wasserstoff oder Methyl steht, oder

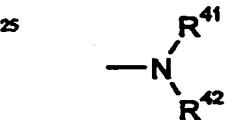
R³⁵ und R³⁶ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morphinyl oder Piperazinyl stehen.

65

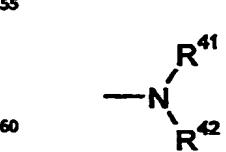
19. Verbindungen der Formel (I-f),



15 in welcher
R³⁷ für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl oder gege-
benenfalls substituiertes Heterocycli steht und
R³⁸ für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Aryl, Heterocycli, Alkoxy oder Dialkylamino
steht oder
R³⁷ und R³⁸ gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cycloalkyliden stehen, und
20 R³⁹ und R⁴⁰ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy,
Alkinyloxy, Arylalkoxy, Cycloalkoxy, Cycloalkenylxy, Aryloxy, Heterocyclxy, Mercapto, Alkylthio, Al-
kenylthio, Alkinylthio, Arylalkylthio, Cycloalkylthio, Cycloalkenylthio, Arylthio, Heterocyclthio oder



30 stehen, wobei
R⁴¹ für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,
R⁴² für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder
R⁴¹ und R⁴² gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes
35 Heterocycli stehen.
20 Verbindungen der Formel (I-f) gemäß Anspruch 19, in welcher
R³⁷ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl
mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach
40 bis dreifach durch Alkyl, Alkoxy, Halogen, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Hetero-
cycl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht und
R³⁸ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl
mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Phenyl, Heterocycli mit 3 bis 7
Ringgliedern, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffat-
men in den Alkylketten steht oder
45 R³⁷ und R³⁸ gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cycloalkyliden mit 3 bis 8
Kohlenstoffatomen stehen, und
R³⁹ und R⁴⁰ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 12
50 Kohlenstoffatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkinyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffat-
men, Phenylalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkyteil, Cycloalkoxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen,
Cycloalkenylxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenoxy, Heterocyclxy mit 3 bis 7 Ringgliedern, Mer-
capto, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenylthio mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkinylthio mit 2
55 bis 4 Kohlenstoffatomen, Arylalkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkyteil, Cycloalkylthio mit 3 bis 7
Kohlenstoffatomen, Cycloalkenylthio mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenylthio, Heterocyclthio mit 3 bis
7 Ringgliedern oder



60 stehen, wobei
R⁴¹ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils
65 gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,
Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1-5 gleichen oder verschie-
denen Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,
R⁴² für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder

DE 196 23 744 A1

R^{41} und R^{42} gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Heterocycl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen.

21. Verbindungen der Formel (I-f) gemäß Anspruch 19, in welcher

R^{37} für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Vinyl, Allyl, Propargyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Phenyl, Methyphenyl, Fluorphenyl, Chlorphenyl, Bromphenyl, Cyanphenyl, Methoxyphenyl, Nitrophenyl, Thienyl, Furyl, Pyridyl oder Chlorpyridyl steht und

R^{38} für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Vinyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Phenyl, Thienyl oder Pyridyl, Methoxy, Ethoxy, Dimethylamino oder Diethylamino steht oder

R^{37} und R^{38} gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cyclopentyliden oder Cyclohexyliden stehen, und

R^{39} und R^{40} gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Pentoxy, Hexyloxy, Heptyloxy, Octyloxy, Nonyloxy, Decyloxy, Undecyloxy, Dodecyloxy, Allyloxy, Propargyloxy, Benzylxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclohexenylxy, Phenoxy, Oxetan-3-yloxy, Mercapto, Methylthio, Ethylthio, Allylthio, Propargylthio, Benzylthio, Cyclopentylthio, Cyclohexylthio, Cyclohexenylthio, Phenylthio, Amino, Methylamino, Ethylamino, Dimethylamino, Phenylamino oder über ein Stickstoffatom gebundenes, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl oder Piperazinyl stehen.

22. Schädlingsbekämpfungsmittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einer Verbindung der Formel (I) nach Anspruch 1.

23. Verfahren zur Bekämpfung von Schädlings, dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (I) nach Anspruch 1 auf Schädlinge und/oder ihren Lebensraum einwirken läßt.

24. Verfahren zur Herstellung von Schädlingsbekämpfungsmitteln, dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (I) nach den Ansprüchen 1 bis 21 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Mitteln vermischt.

30

35

40

45

50

55

60

65